

10|530,513

(19)日本国特許庁 (J P)

## (12) 公開特許公報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開平8-176112

(43)公開日 平成8年(1996)7月9日

(51) Int.Cl.<sup>6</sup>  
 C 07 D 213/78  
 A 01 N 43/08  
 43/26  
 43/32  
 43/54

識別記号 庁内整理番号  
 B

F I

技術表示箇所

審査請求 未請求 請求項の数2 OL (全21頁) 最終頁に続ぐ

(21)出願番号 特願平6-320411

(22)出願日 平成6年(1994)12月22日

(71)出願人 000003126

三井東圧化学株式会社

東京都千代田区霞が関三丁目2番5号

(72)発明者 富谷 完治

千葉県茂原市東郷1144番地 三井東圧化学  
株式会社内

(72)発明者 吉川 幸宏

千葉県茂原市東郷1144番地 三井東圧化学  
株式会社内

(72)発明者 川島 秀雄

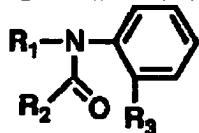
千葉県茂原市東郷1144番地 三井東圧化学  
株式会社内

最終頁に続ぐ

(54)【発明の名称】 N, N-ジ置換アニリン誘導体およびこれを有効成分とする農園芸用殺菌剤

## (57)【要約】

【構成】 一般式(1)



(1)

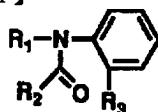
(式中、R<sup>1</sup>は種々のアシル基、カルバモイル基、アルコキシアルキル基等を表し、R<sup>2</sup>は置換基を有するフェニル基、種々のヘテロ環を表し、R<sup>3</sup>はフェニル基、種々のヘテロ環、アルケニル基等を表す。)で表されるN, N-ジ置換アニリン誘導体およびこれを有効成分とする農園芸用殺菌剤。

【効果】 一般式(1)で表されるN, N-ジ置換アニリン誘導体は、幅広い殺菌スペクトラムを有し、特に灰色カビ病菌等に対し、極めて優れた効果を有する。

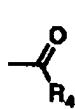
## 【特許請求の範囲】

【請求項1】 一般式(1) (化1)

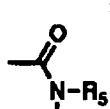
【化1】



(1)



A-1



A-3

\*

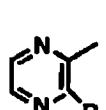
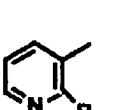
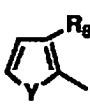
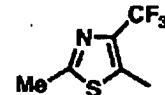
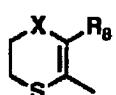
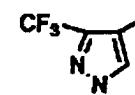
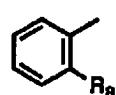


A-4

(式中、 $\text{R}^1$  は炭素数1～8個のアルキル基、炭素数1～8個のハロアルキル基、フェノキシメチル基を、 $\text{R}^5$  は炭素数1～8個のアルキル基あるいはフェニル基を表し、 $\text{R}^6$  は炭素数1～8個のアルキル基、炭素数1～8個のアルコキシアルキル基を表し、 $\text{R}^7$  は炭素数1～8※

※個のアルキル基を表す。)  $\text{R}^2$  は以下の化学式(化3)で表されるB-1ないしB-8のいずれかの基を意味し、

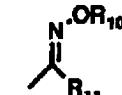
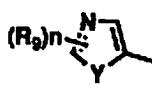
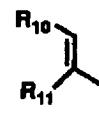
【化3】



(式中、 $\text{R}^8$  はハロゲン原子、炭素数1～8個のアルキル基あるいは炭素数1～8個のハロアルキル基を、Xはメチレン基あるいは酸素原子を、Yは酸素原子あるいは★30

★硫黄原子を表す)  $\text{R}^3$  は以下の化学式(化4)で表されるC-1ないしC-9のいずれかの基を意味する。

【化4】



(式中、 $\text{R}^9$  は水素原子、炭素数1～8個のアルキル基、炭素数1～8個のハロアルキル基を、 $\text{R}^{10}$ 、 $\text{R}^{11}$  は水素原子、または炭素数1～8個のアルキル基を、Yは酸素原子あるいは硫黄原子を表す。またnは1から3の整数でnが2以上の時、 $\text{R}^9$  は同一であっても異なっていてもよい。) ] で表されるN, N-ジ置換アニリン誘導体。

【請求項2】 請求項1記載のN, N-ジ置換アニリン誘導体を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

40 【産業上の利用分野】 本発明はアミド基の窒素原子にアシル基、アルコキシアルキル基もしくはカルバモイル基を導入したカルボン酸アミド誘導体、及び該誘導体を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤に関する。

【0002】

【従来の技術】 従来から極めて多岐にわたるカルボン酸アミド類が除草剤、殺菌剤として活性を示すことが広く知られており、中でも安息香酸アミド、あるいはヘテロ環カルボン酸アミドについては、殺菌剤として市販されている薬剤も多い。例えば、安息香酸アミドとして3'-イソプロピルオキシ-2-メチルベンズアミド、あ

50

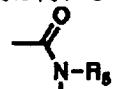
るいは $\alpha$ 、 $\alpha$ 、 $\alpha$ -トリフルオロー-3'-イソプロピルオキシ-2-トルアニリドはイネ紋枯病、ムギのさび病等に対する殺菌剤として市販されている。また、ヘテロ環カルボン酸アミドとしては5, 6-ジヒドロ-2-メチル-1, 4-オキサチイン-3-カルボキシアニリド-4, 4-ジオキシドはキク白さび病、3, 4-ジヒドロ-6-メチル-2H-ピラン-5-カルボキシアニリドはムギのさび病に対する殺菌剤として市販されている。

【0003】更に、Pestic. Sci., 38, 1 ~7 (1993) には、チアゾールカルボン酸アミドがコハク酸脱水素酵素の働きを阻害することにより、R. hizoctonia 菌に対して活性を有すること、Aus. J. Chem., 36, 135~147 (1983) には、ピラゾールカルボン酸アミドが同様に R. hizoctonia 菌に対して活性を有することが記載されている。

【0004】一方特開平5-221, 994号公報および特開平6-199, 803号公報には、アミノ基のO一位にアルキル基、アルコキシ基、アルケニル基、アルケニルオキシ基、アルキニル基、アルキニルオキシ基、シクロアルケニルオキシ基またはフェニル基の置換した種々の芳香族カルボン酸アミド類が灰色カビ病 (Botrytis 菌) に効果を有することが記載されている。しかしながらそこに記載されている化合物は何れも\*



A-1



A-2

10 20

10

20

\*アミドの窒素原子上に水素原子を有したものであり、そこに具体的に開示された化合物について灰色カビ病に対する殺菌活性を試験したが、防除効果が低く、実用的なものではなかった。

## 【0005】

【発明が解決しようとする課題】従って、本発明の課題は優れた病害防除効果を示すと共に、作物に対しても安全で、なおかつ新規な構造を有する農園芸用殺菌剤を提供することにある。

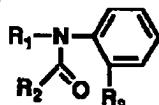
## 【0006】

【発明を解決するための手段および作用】本発明者等は前記課題を解決するため、鋭意検討した結果、N, N-ジ置換アニリン誘導体が灰色カビ病に対し強力な防除効果を示すことを見出し、本発明を完成した。

## 【0007】即ち、本発明は、一般式(1) (化5)

## 【0008】

## 【化5】



(1)

【式中、R<sup>1</sup> は以下の化学式(化6)で表される A-1 ないし A-4 のいずれかの基を意味し、

## 【0009】

## 【化6】



-R7

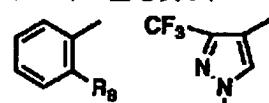
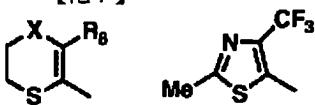
A-3

A-4

※炭素数1~8個のアルキル基を表す。) R<sup>2</sup> は以下の化学式(化7)で表される B-1 ないし B-8 のいずれかの基を意味し、

## 【0011】

## 【化7】

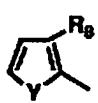


B-1

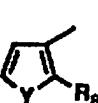
B-2

B-3

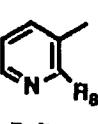
B-4



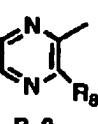
B-5



B-6



B-7



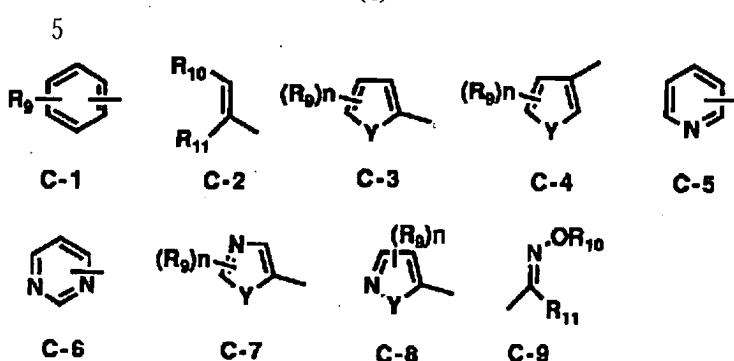
B-8

【0012】(式中、R<sup>8</sup> はハロゲン原子、炭素数1~8個のアルキル基あるいは炭素数1~8個のハロアルキル基を、Xはメチレン基あるいは酸素原子を、Yは酸素原子あるいは硫黄原子を表す) R<sup>3</sup> は以下の化学式(化

8) で表される C-1 ないし C-9 のいずれかの基を意味する。

## 【0013】

## 【化8】



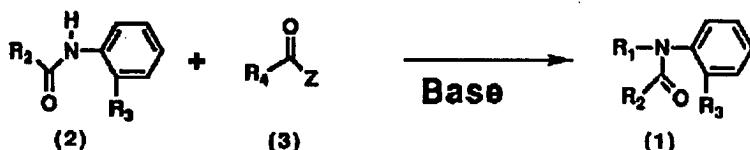
【0014】(式中、 $R^9$  は水素原子、炭素数1~8個のアルキル基、炭素数1~8個のハロアルキル基を、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$  は水素原子、または炭素数1~8個のアルキル基を、Yは酸素原子あるいは硫黄原子を表す。またnは1から3の整数でnが2以上の時、 $R^9$  は同一であっても異なっていてもよい。)】で表されるN,N-ジ置換アニリン誘導体及び該誘導体を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤である。

10\* 【0015】本発明の一般式(1)で表されるアミド誘導体は新規な化合物であり、下記反応式1ないし4(化9)で表される方法により、一般式(2)で表されるカルボン酸アミドと一般式(3)、(4)、(5)あるいは(6)で表される化合物を塩基存在下に反応させることにより製造できる。

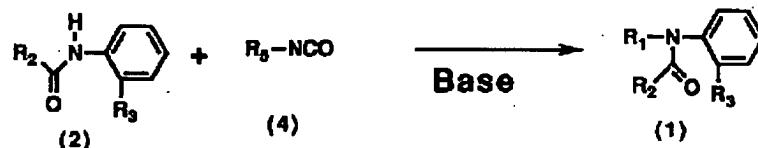
【0016】

【化9】

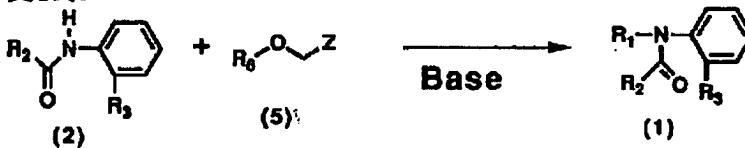
反応式1



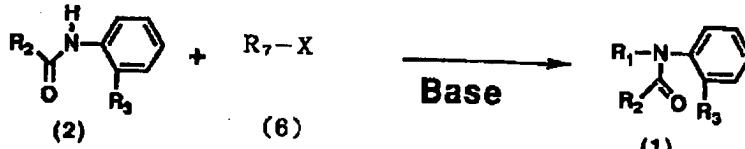
反応式2



反応式3



反応式4



【0017】(式中、 $R^1$  は、反応式1で前記の基A-1を、反応式2で前記の基A-2を、反応式3で前記の基A-3を、反応式4で前記の基A-4を表し、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  及び $R^7$  は前記と同じ意味を表し、Zは塩素もしくは臭素を表す。)

【0018】本発明に使用できる溶媒としては反応に不活性であればよく、例えばエーテル、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ジメチルイミダゾリノン等の非プロトン性極性溶媒、ヘキサン、石油エーテル等の脂肪族炭化水素、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類等が挙げ

40 られ、これらの混合溶媒も使用できる。

【0019】本発明反応に用いられる塩基としてはアルカリ金属およびアルカリ土類金属の水素化物、例えば水素化ナトリウム、水素化カリウム等、アルカリ金属のアミド、例えばリチウムアミド、ナトリウムアミド等；アルカリ金属およびアルカリ土類金属の水酸化物、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等、アルカリ金属のアミド、例えばリチウムアミド、ナトリウムアミド等、アルカリ金属およびアルカリ土類金属の炭酸塩、例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸カルシウム、炭酸マグネシウム等、アルカリ金属およ

びアルカリ土類金属の炭酸水素塩、例えば炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、アルカリ金属アルキル、例えばメチルリチウム、ブチルリチウム、フェニルリチウム、メチルマグネシウムクロライド、アルカリ金属およびアルカリ土類金属のアルコキシド、例えばナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム-*t*-ブトキシド、ジメトキシマグネシウム等、種々の有機塩基類、例えばトリエチルアミン、ピリジン、N、N-ジメチルアニリン、N-メチルピペリジン、ルチジン、4-ジメチルアミノピリジン等が挙げられ、特に好ましくは  
10 水素化ナトリウム、ナトリウムアミドである。これらの塩基の使用量は特に制限されるものではないが、好まし\*

第1表 ( $R^2 = 2$ -クロロフェニルの場合)

$R^1$	$R^3$
アセチル	フェニル
アセチル	イソプロペニル
エタノイル	フェニル
エタノイル	イソプロペニル
プロパノイル	フェニル
プロパノイル	イソプロペニル
ブタノイル	フェニル
ブタノイル	イソプロペニル
ペンタノイル	フェニル
ペンタノイル	イソプロペニル
ヘキサノイル	フェニル
ヘキサノイル	イソプロペニル
N-エチルカルバモイル	フェニル
N-エチルカルバモイル	イソプロペニル
N-メチルカルバモイル	フェニル
N-メチルカルバモイル	イソプロペニル
N-フェニルカルバモイル	フェニル
N-フェニルカルバモイル	イソプロペニル
フェノキシメチル	フェニル
フェノキシメチル	イソプロペニル
メトキシメチル	フェニル

## 【0022】

※ ※ 【表2】

第1表 ( $R^2 = 2$ -クロロフェニルの場合)

$R^1$	$R^3$
メトキシメチル	イソプロペニル
メトキシエトキシメチル	フェニル
メトキシエトキシメチル	イソプロペニル

## 【0023】

★ ★ 【表3】

第2表 ( $R^2 = 3$ -トリフルオロメチル-1-メチル-4-ピラゾリルの場合

\* くは一般式(2)で表されるカルボン酸アミドに対して5モル%から20モル%過剰に使用される。

【0020】以上の製造方法により製造できる本発明に係わる一般式(1)のN、N-ジ置換アニリン誘導体で農園芸用殺菌剤として好ましく用いられる化合物を以下の第1表(表1、2)、第2表(表3~8)、第3表(表9、10)、第4表(表11~16)、第5表(表17、18)、第6表(表19、20)、第7表(表21、22)及び第8表(表23、24)に列挙する。

## 【0021】

【表1】

$R^1$	$R^3$
アセチル	フェニル
アセチル	イソプロペニル
アセチル	2-チエニル
アセチル	5-メチル-2-チエニル
アセチル	3-チエニル
アセチル	2-フリル
アセチル	2-ピリジル
アセチル	2-ピリミジル
アセチル	5-チアゾリル
アセチル	5-イソオキサゾリル
アセチル	1-(メトキシイミノ)エチル
エタノイル	フェニル
エタノイル	イソプロペニル
エタノイル	2-チエニル
エタノイル	5-メチル-2-チエニル
エタノイル	3-チエニル
エタノイル	2-フリル
エタノイル	2-ピリジル
エタノイル	2-ピリミジル
エタノイル	5-チアゾリル

【0024】

\* \* 【表4】

第2表 (つづき)

$R^1$	$R^3$
エタノイル	5-イソオキサゾリル
エタノイル	1-(メトキシイミノ)エチル
プロパノイル	フェニル
プロパノイル	イソプロペニル
プロパノイル	2-チエニル
プロパノイル	5-メチル-2-チエニル
プロパノイル	3-チエニル
プロパノイル	2-フリル
プロパノイル	2-ピリジル
プロパノイル	2-ピリミジル
プロパノイル	5-チアゾリル
プロパノイル	5-イソオキサゾリル
プロパノイル	1-(メトキシイミノ)エチル
ブタノイル	フェニル
ブタノイル	イソプロペニル
ブタノイル	2-チエニル
ブタノイル	5-メチル-2-チエニル
ブタノイル	3-チエニル
ブタノイル	2-フリル
ブタノイル	2-ピリジル
ブタノイル	2-ピリミジル

【0025】

\* \* 【表5】

第2表 (つづき)

$R^1$	$R^3$
ブタノイル	5-チアゾリル
ブタノイル	5-イソオキサゾリル
ブタノイル	1-(メトキシイミノ)エチル
ペンタノイル	フェニル
ペンタノイル	イソプロペニル
ペンタノイル	2-チエニル
ペンタノイル	5-メチル-2-チエニル
ペンタノイル	3-チエニル
ペンタノイル	2-フリル
ペンタノイル	2-ピリジル
ペンタノイル	2-ピリミジル
ペンタノイル	5-チアゾリル
ペンタノイル	5-イソオキサゾリル
ペンタノイル	1-(メトキシイミノ)エチル
ヘキサノイル	フェニル
ヘキサノイル	イソプロペニル
ヘキサノイル	2-チエニル
ヘキサノイル	5-メチル-2-チエニル
ヘキサノイル	3-チエニル
ヘキサノイル	2-フリル

【0026】

\* \* 【表6】

第2表 (つづき)

$R^1$	$R^3$
ヘキサノイル	2-ピリジル
ヘキサノイル	2-ピリミジル
ヘキサノイル	5-チアゾリル
ヘキサノイル	5-イソオキサゾリル
ヘキサノイル	1-(メトキシイミノ)エチル
N-エチルカルバモイル	フェニル
N-エチルカルバモイル	イソプロペニル
N-エチルカルバモイル	2-チエニル
N-エチルカルバモイル	5-メチル-2-チエニル
N-エチルカルバモイル	3-チエニル
N-エチルカルバモイル	2-フリル
N-エチルカルバモイル	2-ピリジル
N-エチルカルバモイル	2-ピリミジル
N-エチルカルバモイル	5-チアゾリル
N-エチルカルバモイル	5-イソオキサゾリル
N-エチルカルバモイル	1-(メトキシイミノ)エチル
N-フェニルカルバモイル	フェニル
N-フェニルカルバモイル	イソプロペニル

13

14

N-フェニルカルバモイル  
N-フェニルカルバモイル

2-チエニル  
5-メチル-2-チエニル

【0027】

\* \* 【表7】

第2表 (つづき)

R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>
N-フェニルカルバモイル	3-チエニル
N-フェニルカルバモイル	2-フリル
N-フェニルカルバモイル	2-ピリジル
N-フェニルカルバモイル	2-ピリミジル
N-フェニルカルバモイル	5-チアゾリル
N-フェニルカルバモイル	5-イソオキサゾリル
N-フェニルカルバモイル	1-(メトキシイミノ)エチル
フェノキシメチル	フェニル
フェノキシメチル	イソプロペニル
フェノキシメチル	2-チエニル
フェノキシメチル	5-メチル-2-チエニル
フェノキシメチル	3-チエニル
フェノキシメチル	2-フリル
フェノキシメチル	2-ピリジル
フェノキシメチル	2-ピリミジル
フェノキシメチル	5-チアゾリル
フェノキシメチル	5-イソオキサゾリル
フェノキシメチル	1-(メトキシイミノ)エチル
メトキシメチル	フェニル
メトキシメチル	イソプロペニル

【0028】

※30※ 【表8】

第2表 (つづき)

R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>
メトキシメチル	2-チエニル
メトキシメチル	5-メチル-2-チエニル
メトキシメチル	3-チエニル
メトキシメチル	2-フリル
メトキシメチル	2-ピリジル
メトキシメチル	2-ピリミジル
メトキシメチル	5-チアゾリル
メトキシメチル	5-イソオキサゾリル
メトキシメチル	1-(メトキシイミノ)エチル
メトキシエトキシメチル	フェニル
メトキシエトキシメチル	イソプロペニル
メトキシエトキシメチル	2-チエニル
メトキシエトキシメチル	5-メチル-2-チエニル
メトキシエトキシメチル	3-チエニル
メトキシエトキシメチル	2-フリル
メトキシエトキシメチル	2-ピリジル

15

16

メトキシエトキシメチル	2-ピリミジル
メトキシエトキシメチル	5-チアゾリル
メトキシエトキシメチル	5-イソオキサゾリル
メトキシエトキシメチル	1-(メトキシイミノ)エチル

【0029】

\* \* 【表9】

第3表 ( $R^2 = 3$ -メチルオキサチイン-2-イルの場合)

$R^1$	$R^3$
アセチル	フェニル
アセチル	イソプロペニル
エタノイル	フェニル
エタノイル	イソプロペニル
プロパノイル	フェニル
プロパノイル	イソプロペニル
ブタノイル	フェニル
ブタノイル	イソプロペニル
ペンタノイル	フェニル
ペンタノイル	イソプロペニル
ヘキサノイル	フェニル
ヘキサノイル	イソプロペニル
N-エチルカルバモイル	フェニル
N-エチルカルバモイル	イソプロペニル
N-メチルカルバモイル	フェニル
N-メチルカルバモイル	イソプロペニル
N-フェニルカルバモイル	フェニル
N-フェニルカルバモイル	イソプロペニル
フェノキシメチル	フェニル
フェノキシメチル	イソプロペニル

【0030】

\* \* 【表10】

第3表 (つづき)

$R^1$	$R^3$
メトキシメチル	フェニル
メトキシメチル	イソプロペニル
メトキシエトキシメチル	フェニル
メトキシエトキシメチル	イソプロペニル

【0031】

★ ★ 【表11】

第4表 ( $R^2 = 4$ -トリフルオロメチル-2-メチル-5-チアゾリルの場合

$R^1$	$R^3$
アセチル	フェニル
アセチル	イソプロペニル
アセチル	2-チエニル

17

アセチル	5-メチル-2-チエニル
アセチル	3-チエニル
アセチル	2-フリル
アセチル	2-ピリジル
アセチル	2-ピリミジル
アセチル	5-チアゾリル
アセチル	5-イソオキサゾリル
アセチル	1-(メトキシイミノ)エチル
エタノイル	フェニル
エタノイル	イソプロペニル
エタノイル	2-チエニル
エタノイル	5-メチル-2-チエニル
エタノイル	3-チエニル
エタノイル	2-フリル
エタノイル	2-ピリジル
エタノイル	2-ピリミジル
エタノイル	5-チアゾリル

18

【0032】

\* \* 【表12】

第4表(つづき)

R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>
エタノイル	5-イソオキサゾリル
エタノイル	1-(メトキシイミノ)エチル
プロパノイル	フェニル
プロパノイル	イソプロペニル
プロパノイル	2-チエニル
プロパノイル	5-メチル-2-チエニル
プロパノイル	3-チエニル
プロパノイル	2-フリル
プロパノイル	2-ピリジル
プロパノイル	2-ピリミジル
プロパノイル	5-チアゾリル
プロパノイル	5-イソオキサゾリル
プロパノイル	1-(メトキシイミノ)エチル
ブタノイル	フェニル
ブタノイル	イソプロペニル
ブタノイル	2-チエニル
ブタノイル	5-メチル-2-チエニル
ブタノイル	3-チエニル
ブタノイル	2-フリル
ブタノイル	2-ピリジル

【0033】

\* \* 【表13】

第4表(つづき)

R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>
ブタノイル	2-ピリミジル

19

ブタノイル  
ブタノイル  
ブタノイル  
ペントノイル  
ヘキサノイル  
ヘキサノイル

20

5-チアゾリル  
5-イソオキサゾリル  
1-(メトキシイミノ)エチル  
フェニル  
イソプロペニル  
2-チエニル  
5-メチル-2-チエニル  
3-チエニル  
2-フリル  
2-ピリジル  
2-ピリミジル  
5-チアゾリル  
5-イソオキサゾリル  
1-(メトキシイミノ)エチル  
フェニル  
イソプロペニル  
2-チエニル  
5-メチル-2-チエニル  
3-チエニル

【0034】

\* \* 【表14】

第4表(つづき)

R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>
ヘキサノイル	2-フリル
ヘキサノイル	2-ピリジル
ヘキサノイル	2-ピリミジル
ヘキサノイル	5-チアゾリル
ヘキサノイル	5-イソオキサゾリル
ヘキサノイル	1-(メトキシイミノ)エチル
N-エチルカルバモイル	フェニル
N-エチルカルバモイル	イソプロペニル
N-エチルカルバモイル	2-チエニル
N-エチルカルバモイル	5-メチル-2-チエニル
N-エチルカルバモイル	3-チエニル
N-エチルカルバモイル	2-フリル
N-エチルカルバモイル	2-ピリジル
N-エチルカルバモイル	2-ピリミジル
N-エチルカルバモイル	5-チアゾリル
N-エチルカルバモイル	5-イソオキサゾリル
N-エチルカルバモイル	1-(メトキシイミノ)エチル
N-フェニルカルバモイル	フェニル
N-フェニルカルバモイル	イソプロペニル
N-フェニルカルバモイル	2-チエニル

【0035】

\* \* 【表15】

第4表(つづき)

R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>
----------------	----------------

N-フェニルカルバモイル	5-メチル-2-チエニル
N-フェニルカルバモイル	3-チエニル
N-フェニルカルバモイル	2-フリル
N-フェニルカルバモイル	2-ピリジル
N-フェニルカルバモイル	2-ピリミジル
N-フェニルカルバモイル	5-チアゾリル
N-フェニルカルバモイル	5-イソオキサゾリル
N-フェニルカルバモイル	1-(メトキシイミノ)エチル
フェノキシメチル	フェニル
フェノキシメチル	イソプロペニル
フェノキシメチル	2-チエニル
フェノキシメチル	5-メチル-2-チエニル
フェノキシメチル	3-チエニル
フェノキシメチル	2-フリル
フェノキシメチル	2-ピリジル
フェノキシメチル	2-ピリミジル
フェノキシメチル	5-チアゾリル
フェノキシメチル	5-イソオキサゾリル
フェノキシメチル	1-(メトキシイミノ)エチル
メトキシメチル	フェニル

【0036】

\* \* 【表16】

第4表 (つづき)

R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>
メトキシメチル	イソプロペニル
メトキシメチル	2-チエニル
メトキシメチル	5-メチル-2-チエニル
メトキシメチル	3-チエニル
メトキシメチル	2-フリル
メトキシメチル	2-ピリジル
メトキシメチル	2-ピリミジル
メトキシメチル	5-チアゾリル
メトキシメチル	5-イソオキサゾリル
メトキシメチル	1-(メトキシイミノ)エチル
メトキシエトキシメチル	フェニル
メトキシエトキシメチル	イソプロペニル
メトキシエトキシメチル	2-チエニル
メトキシエトキシメチル	5-メチル-2-チエニル
メトキシエトキシメチル	3-チエニル
メトキシエトキシメチル	2-フリル
メトキシエトキシメチル	2-ピリジル
メトキシエトキシメチル	2-ピリミジル
メトキシエトキシメチル	5-チアゾリル
メトキシエトキシメチル	5-イソオキサゾリル
メトキシエトキシメチル	1-(メトキシイミノ)エチル

【0037】

50 【表17】

第5表 ( $R^2 = 3$ -メチル-2-チエニルの場合)

$R^1$	$R^3$
アセチル	フェニル
アセチル	イソプロペニル
エタノイル	フェニル
エタノイル	イソプロペニル
プロパノイル	フェニル
プロパノイル	イソプロペニル
ブタノイル	フェニル
ブタノイル	イソプロペニル
ペンタノイル	フェニル
ペンタノイル	イソプロペニル
ヘキサノイル	フェニル
ヘキサノイル	イソプロペニル
N-エチルカルバモイル	フェニル
N-エチルカルバモイル	イソプロペニル
N-メチルカルバモイル	フェニル
N-メチルカルバモイル	イソプロペニル
N-フェニルカルバモイル	フェニル
N-フェニルカルバモイル	イソプロペニル
フェノキシメチル	フェニル
フェノキシメチル	イソプロペニル

【0038】

\* \* 【表18】

第5表 (つづき)

$R^1$	$R^3$
メトキシメチル	フェニル
メトキシメチル	イソプロペニル
メトキシエトキシメチル	フェニル
メトキシエトキシメチル	イソプロペニル

【0039】

\* \* 【表19】

第6表 ( $R^2 = 2$ -メチル-3-フリルの場合)

$R^1$	$R^3$
アセチル	フェニル
アセチル	イソプロペニル
エタノイル	フェニル
エタノイル	イソプロペニル
プロパノイル	フェニル
プロパノイル	イソプロペニル
ブタノイル	フェニル
ブタノイル	イソプロペニル
ペンタノイル	フェニル
ペンタノイル	イソプロペニル

25

26

ヘキサノイル	フェニル
ヘキサノイル	イソプロペニル
N-エチルカルバモイル	フェニル
N-エチルカルバモイル	イソプロペニル
N-メチルカルバモイル	フェニル
N-メチルカルバモイル	イソプロペニル
N-フェニルカルバモイル	フェニル
N-フェニルカルバモイル	イソプロペニル
フェノキシメチル	フェニル
フェノキシメチル	イソプロペニル

【0040】

\* \* 【表20】

第6表 (つづき)

R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>
メトキシメチル	フェニル
メトキシメチル	イソプロペニル
メトキシエトキシメチル	フェニル
メトキシエトキシメチル	イソプロペニル

【0041】

※ ※ 【表21】

第7表 (R<sup>2</sup> = 2-クロロ-3-ピリジルの場合)

R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>
アセチル	フェニル
アセチル	イソプロペニル
エタノイル	フェニル
エタノイル	イソプロペニル
プロパノイル	フェニル
プロパノイル	イソプロペニル
ブタノイル	フェニル
ブタノイル	イソプロペニル
ペンタノイル	フェニル
ペンタノイル	イソプロペニル
ヘキサノイル	フェニル
ヘキサノイル	イソプロペニル
N-エチルカルバモイル	フェニル
N-エチルカルバモイル	イソプロペニル
N-メチルカルバモイル	フェニル
N-メチルカルバモイル	イソプロペニル
N-フェニルカルバモイル	フェニル
N-フェニルカルバモイル	イソプロペニル
フェノキシメチル	フェニル
フェノキシメチル	イソプロペニル

【0042】

★ ★ 【表22】

第7表 (つづき)

メトキシメチル	フェニル
メトキシメチル	イソプロペニル
メトキシエトキシメチル	フェニル
メトキシエトキシメチル	イソプロペニル

【0043】

\* \* 【表23】

第8表 (R<sup>2</sup> = 2-クロロ-3-ピラジニルの場合)

R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>
アセチル	フェニル
アセチル	イソプロペニル
エタノイル	フェニル
エタノイル	イソプロペニル
プロパノイル	フェニル
プロパノイル	イソプロペニル
ブタノイル	フェニル
ブタノイル	イソプロペニル
ペンタノイル	フェニル
ペンタノイル	イソプロペニル
ヘキサノイル	フェニル
ヘキサノイル	イソプロペニル
N-エチルカルバモイル	フェニル
N-エチルカルバモイル	イソプロペニル
N-メチルカルバモイル	フェニル
N-メチルカルバモイル	イソプロペニル
N-フェニルカルバモイル	フェニル
N-フェニルカルバモイル	イソプロペニル
フェノキシメチル	フェニル
フェノキシメチル	イソプロペニル

【0044】

\* \* 【表24】

第8表 (つづき)

R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>
メトキシメチル	フェニル
メトキシメチル	イソプロペニル
メトキシエトキシメチル	フェニル
メトキシエトキシメチル	イソプロペニル

【0045】本発明の一般式(1)で表わされる化合物は、キュウリ、トマト、イチゴ、ブドウ等の灰色かび病(*Botrytis cinerea*)の他、ウリ類のうどんこ病(*Sphaerotheca fuliginea*)、ムギ類のうどんこ病(*Erysiphe graminis* f. sp. *hordei*, f. sp. *tritici*)、イチゴうどんこ病(*Sphaerotheca humuli*)、ブドウうどんこ病(*Uncinula necator*)、リンゴうどんこ病(*Podosphaera leucotricha*)<sup>50</sup>

a)、リンゴ黒星病(*Venturia inaequalis*)、ナシ黒星病(*Venturia nashicola*)、リンゴ赤星病(*Gymnosporangium yamadae*)、ナシ黒斑病(*Alternaria kikuchiana*)、リンゴ斑点落葉病(*Alternaria malii*)、ムギ類のさび病(*Puccinia striiformis*, *P. graminis*, *P. recondita*, *P. hordei*)等に対し優れた防除効果を示す。

【0046】本発明に係わる一般式(1)で表わされる

化合物を農園芸用殺菌剤として使用する場合は、処理する植物に対して原体をそのまま使用してもよいが、一般には不活性な液体担体または固体担体と混合し、通常用いられる製剤形態である粉剤、水和剤、フロワブル剤、乳剤、粒剤およびその他の一般に慣用される形態の製剤として使用される。更に製剤上必要ならば補助剤を添加することもできる。

【0047】ここでいう担体とは、処理すべき部位への有効成分の到達を助け、また有効成分化合物の貯蔵、輸送、取扱いを容易にするために配合される合成または天然の無機または有機物質を意味する。担体としては、通常農園芸用薬剤に使用されるものであるならば固体または液体のいずれでも使用でき、特定のものに限定されるものではない。

【0048】例えば、固体担体としては、モンモリロナイト、カオリナイト等の粘土類、珪藻土、白土、タルク、バーミュキュライト、石膏、炭酸カルシウム、シリカゲル、硫安等の無機物質、大豆粉、鋸屑、小麦粉等の植物性有機物質および尿素等があげられる。

【0049】液体担体としては、トルエン、キシレン、クメン等の芳香族炭化水素類、ケロシン、鉱油などのパラフィン系炭化水素類、アセトン、メチルエチルケトンなどのケトン類、ジオキサン、ジエチレングリコールジメチルエーテルなどのエーテル類、メタノール、エタノール、プロパンノール、エチレングリコールなどのアルコール類、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシドおよび水等があげられる。

【0050】更に本発明化合物の効力を増強するために、製剤の剤型、適用場面等を考慮して目的に応じてそれぞれ単独に、または組み合わせて次の様な補助剤を使用することも出来る。補助剤としては、通常農園芸用薬剤に使用される界面活性剤、結合剤（例えば、リグニンスルホン酸、アルギン酸、ポリビニルアルコール、アラビアゴム、CMCナトリウム等）、安定剤（例えば、酸化防止用にフェノール系化合物、チオール系化合物または高級脂肪酸エステル等を用いたり、pH調整剤として磷酸塩を用いたり、時に光安定剤も用いる）等を必要に応じて単独または組み合わせて使用出来る。更に場合によっては防菌防黴のために工業用殺菌剤、防菌防黴剤などを添加することもできる。

【0051】補助剤について更に詳しく述べる。乳化、分散、拡展、湿潤、結合、安定化等の目的ではリグニンスルホン酸塩、アルキルベンゼンスルホン酸塩、アルキル硫酸エステル塩、ポリオキシアルキレンアルキル硫酸塩、ポリオキシアルキレンアルキルリン酸エステル塩等のアニオン性界面活性剤、ポリオキシアルキレンアルキルエーテル、ポリオキシアルキレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシアルキレンアルキルアミド、ポリオキシアルキレンアルキルアミド、ポリオキシアルキレンアルキルチオエ

ーテル、ポリオキシアルキレン脂肪酸エステル、グリセリン脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシアルキレンソルビタン脂肪酸エステル、ポリオキシプロピレンポリオキシエチレンブロックポリマー等の非イオン性界面活性剤、ステアリン酸カルシウム、ワックス等の滑剤、イソプロピルヒドロジェンホスフェート等の安定剤、その他メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、カゼイン、アラビアゴム等があげられる。しかし、これらの成分は以上のものに限定されるものではない。

【0052】本発明に係わる農園芸用殺菌剤における一般式（1）で表わされる化合物の含有量は、製剤形態によっても異なるが、通常粉剤では0.05～20重量%、水和剤では0.1～80重量%、乳剤では1～50重量%、フロワブル製剤では1～50重量%、ドライフロワブル製剤では1～80重量%であり、好ましくは、粉剤では0.5～5重量%、水和剤では5～80重量%、粒剤では0.5～8重量%、乳剤では5～20重量%、フロワブル製剤では5～30重量%およびドライフロワブル製剤では5～50重量%である。

【0053】補助剤の含有量は0～80重量%であり、担体の含有量は、100重量%から有効成分化合物および補助剤の含有量を差し引いた量である。

【0054】本発明組成物の施用方法としては種子消毒、茎葉散布等があげられるが、通常当業者が利用するどの様な施用方法にても十分な効力を發揮する。施用量および施用濃度は対象作物、対象病害、病害の発生程度、化合物の剤型、施用方法および各種環境条件等によって変動するが、散布する場合には有効成分量としてヘクタール当たり50～1,000gが適当であり、望ましくはヘクタール当たり100～500gである。また水和剤、フロワブル剤または乳剤を水で希釈して散布する場合、その希釈倍率は200～20,000倍が適当であり、望ましくは1,000～5,000倍である。

【0055】本発明の農園芸用殺菌剤は他の殺菌剤、殺虫剤、除草剤および植物成長調節剤等の農薬、土壤改良剤または肥効物質との混合使用は勿論のこと、これらとの混合製剤も可能である。殺菌剤としては例えば、トリアジメホン、ヘキサコナゾール、プロクロラズ、トリフルミゾール等のアゾール系殺菌剤、メタラキシル、オキサディキシル等のアシルアラニン系殺菌剤、チオファネートメチル、ベノミル等のベンズイミダゾール系殺菌剤、マンゼブ等のジチオカーバメート系殺菌剤およびテトラクロロイソフタロニトリル、硫黄等があげられ、殺虫剤としては例えば、フェニトロチオン、ダイアジノン、ピリダafenチオン、クロルピリホス、マラソン、フェントエート、ジメトエート、メチルチオメトン、プロチオホス、DDVP、アセフェート、サリチオン、EPN等リン系殺虫剤、NAC、MTMC、BPMC、ピリミカーブ、カルボスルファン、メソミル等のカーバメ

ート系殺虫剤およびエトフェンプロックス、ペルメトリ<sup>n</sup>、フェンバレレート等のピレスロイド系殺虫剤等があげられるが、これに限定されるものではない。

### 【0056】

【実施例】次に実施例を挙げて本発明化合物の製造法を具体的に説明する。

実施例1 N-アセチル-N-(2-フェニル)フェニル4-トリフルオロメチル-2-メチルチアゾール-5-カルボン酸アミドの合成

60%水素化ナトリウム0.03gをTHF 10mlに懸濁させ氷冷攪拌下にN-(2-フェニル)フェニル4-トリフルオロメチル-2-メチルチアゾール-5-カルボン酸アミド0.20g(0.52mmol)のTHF 2ml溶液を滴下した。5分間同温度で攪拌した後無水酢酸0.07g(0.98mmol)を滴下した。

徐々に室温まで昇温させながら攪拌し溶媒を水中に注ぎ込み酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和重曹水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下に留去し目的物を結晶として0.16g(収率71.7%)を得た。

<sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>, δ値): 2.04(3H,s), 2.69(3H,s), 7.22-7.37(4H,m), 7.40-7.70(5H,m)

\* 【0057】実施例2 N-(N-エチルカルバモイル)-N-(2-フェニル)フェニル4-トリフルオロメチル-2-メチルチアゾール-5-カルボン酸アミドの合成

60%水素化ナトリウム0.03gをTHF 10mlに懸濁させ氷冷攪拌下にN-(2-フェニル)フェニル4-トリフルオロメチル-2-メチルチアゾール-5-カルボン酸アミド0.25g(0.69mmol)のTHF 2ml溶液を滴下した。5分間同温度で攪拌した後

10 イソシアニ酸エチル0.05mlを滴下した。徐々に室温まで昇温させながら攪拌し溶媒を水中に注ぎ込み酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和重曹水で順次洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下に留去し目的物を結晶として0.24g(収率80.0%)を得た。

<sup>1</sup>H NMR(CDCl<sub>3</sub>, δ値): 1.21(3H,t J=7.3Hz), 2.57(3H,s), 3.41(2H,m), 7.13-7.18(2H,m), 7.28-7.50(7H,m), 8.46(1H,bs)

【0058】この様な製造例によって製造される本発明の化合物のいくつかを第9表(表25~27)に示す。

### 【0059】

#### 【表25】

第9表

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	NMR(CDCl <sub>3</sub> , δ値)
1 アセチル	4-トリフルオロメチル-2-メチル -5-チアゾリル	フェニル		2.04(3H,s), 2.69(3H,s), 7.22-7.37(4H,m), 7.40-7.72 (5H,m)
2 イソブチリル	4-トリフルオロメチル-2-メチル -5-チアゾリル	フェニル		0.73(3H,d J=7.3Hz), 1.00(3H,d J=7.3Hz), 2.50(1H,septet J=7.3Hz), 2.70(3H,s), 7.23-7.57(9H,m)
3 ヘプタノイル	4-トリフルオロメチル-2-メチル -5-チアゾリル	フェニル		0.83(3H,t J=7.3Hz), 1.09-1.38(8H,m), 2.05-2.81(2H,m) 2.68(3H,s), 7.22-7.57(9H,m)
4 フェノキシアセチル	4-トリフルオロメチル-2-メチル -5-チアゾリル	フェニル		2.64(3H,s), 4.76(1H,d J=4.3Hz), 4.79(1H,d J=4.3Hz) 6.69(2H,m), 7.20-7.34(6H,m) 7.42-7.64(6H,m)
5 N-フェニルカルバモイル	4-トリフルオロメチル-2-メチル -5-チアゾリル	フェニル		2.28(3H,s), 6.51(1H,bs) 7.15(2H,m), 7.34-7.54(14H,m)

第9表 (つづき)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	NMR(CDCl <sub>3</sub> , δ 値)
6	N-エチル カルバモイル	4-トリフルオロメチル-2-メチル -5-チアゾリル	フェニル	1.21(3H, t J=7.3Hz), 2.57(3H, s), 3.41(2H, m), 7.13-7.18(2H, m), 7.28-7.50(7H, m), 8.46(1H, bs)
7	メチル	4-トリフルオロメチル-2-メチル -5-チアゾリル	フェニル	2.55(3H, s), 3.25(3H, s), 7.18-7.25(2H, m), 7.31-7.48(7H, m)
8	メキシメチル	4-トリフルオロメチル-2-メチル -5-チアゾリル	フェニル	3.47(3H, s), 4.43(1H, d J=10.1Hz), 5.54(1H, d, J=10.1Hz), 7.15-7.19(3H, m), 7.26-7.50(6H, m)
9	メキシドキシ メチル	4-トリフルオロメチル-2-メチル -5-チアゾリル	フェニル	2.56(3H, s), 3.37(3H, s), 3.53 3.57(2H, m), 3.77-3.95(2H, m) 4.55(1H, d J=10.3Hz), 5.65(1H, d J=10.3Hz), 7.32-7.44(9H, m)

【0061】

\* \* 【表27】

第9表 (つづき)

化合物 番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	NMR(CDCl <sub>3</sub> , δ 値)
10	アセチル	4-トリフルオロメチル-2-メチル -5-チアゾリル	2-メキシ ビノエチル	2.17(3H, s), 2.44(3H, s), 2.60 (3H, s), 3.94(3H, s), 7.16(1H, d J=8.1Hz), 7.31-7.45(2H, m), 7.53(1H, d J=8.1Hz)
11	アセチル	3-トリフルオロメチル-1-メチル -4-ビラゾリル	フェニル	2.08(3H, s), 3.92(3H, s), 7.26-7.33(4H, m), 7.42-7.70(5H, m)
12	プロパンオイル	4-トリフルオロメチル-2-メチル -5-チアゾリル	フェニル	0.73(3H, t d J=7.3Hz), 2.10 2.35(2H, m), 2.68(3H, s), 7.19-7.57(9H, m)

【0062】参考例1 N-(2-イソプロピルフェニル)-2-メチル-4-トリフルオロメチルチアゾール-5-カルボン酸アミド (対照化合物A、特開平-221, 994号公報に記載の化合物)

実施例1においてアニリンとして2-イソプロピルアニリンを、カルボン酸として2-メチル-4-トリフルオ

ロメチルチアゾール-5-カルボン酸を用いた以外は全く同様の方法で行った。融点114~115℃の目的化合物を得た。

【0063】参考例2 N-(2-イソプロピルフェニル)-2-クロロニコチン酸アミド (対照化合物B、特開平-221, 994号公報に記載の化合物)

実施例1においてアニリンとして2-イソプロピルアニリンを用いた以外は全く同様の方法で行った。融点123~124.5℃の目的化合物を得た。

**【0064】製剤例および生理試験例**

次に本発明に係る農園芸用殺菌剤の製剤例および試験例を示す。

**製剤例1 粉剤**

化合物番号1の化合物3部、ケイソウ土20部、白土30部およびタルク47部を均一に粉碎混合して粉剤100部を得た。

**【0065】製剤例2 水和剤**

化合物番号1の化合物25部、ケイソウ土47部、白土25部、リグニンスルホン酸ナトリウム1部およびアルキルベンゼンスルホン酸ナトリウム2部を均一に粉碎混合して水和剤100部を得た。

**【0066】製剤例3 水和剤**

化合物番号1の化合物50部、タルク40部、ラウリルリン酸ナトリウム5部およびアルキルナフタレンスルホン酸サトリウム5部を混合し、水和剤100部を得た。

**【0067】製剤例4 水和剤**

化合物番号2の化合物50部、リグニンスルホン酸ナトリウム10部、アルキルナフタレンスルホン酸ナトリウム5部、ホワイトカーボン10部およびケイソウ土25部を混合粉碎し、水和剤100部を得た。

**【0068】製剤例5 乳剤**

化合物番号2の化合物10部、シクロヘキサン10部、キシレン60部およびソルボール(東邦化学製界面活性剤)20部を均一に溶解混合し、乳剤100部を得た。

**【0069】製剤例6 フロワブル剤**

化合物番号2の化合物40部、カルボキシメチルセルロ 30

ース3部、リグニンスルホン酸ナトリウム2部、ジオクチルスルホサクシネートナトリウム塩1部および水54部をサンドグラインダーで湿式粉碎し、フロワブル剤100部を得た。

**【0070】**次に本発明化合物の農園芸用殺菌剤としての効力を試験例によって説明する。なお試験例においては、上記参考例の化合物を対照剤として用いた。

**試験例1 インゲン灰色かび病防除効果試験**

温室内で直径7.5cmのビニールポットに子葉の展開まで2本づつ生育させたインゲン(品種:つるなしトップクロップ)に、製剤例3に準じて調整した水和剤を所定濃度に希釈して、4ポット当たり50mlづつ散布した。薬液が風乾した後、PDA培地上で培養した灰色かび病菌から調製した分生胞子懸濁液( $1 \times 10^5$ 個/m<sup>1</sup>)を子葉上に噴霧接種し、20~23℃、湿度95%以上の温室内に7日間保った。接種7日後、インゲン1葉当たりに灰色かび病の病斑が占める面積を次の指標に従って調査し、下記式(数1)により防除価を算出した。結果を第10表(表28、29)に示す。

20 発病度 0:発病なし

1:病斑の面積が5%以下

2:病斑の面積が5~25%

3:病斑の面積が25~50%

4:病斑の面積が50%以上

各処理区および無処理区の平均値を発病度とした

**【0071】**

【数1】防除価(%) = (1 - 処理区の発病度 / 無処理区の発病度) × 100

**【0072】**

【表28】

37  
第10表

38

化合物番号	有効成分濃度 (ppm)	防除価 (%)
本発明化合物 1	200	100
	50	100
本発明化合物 4	200	100
	50	33
本発明化合物 7	200	100
	50	67
本発明化合物 8	200	100
	50	100
本発明化合物 10	200	100
	50	33
本発明化合物 11	200	100
	50	100

【0073】

\* \* 【表29】

第10表

化合物番号	有効成分濃度 (ppm)	防除価 (%)
対照化合物 A	200	90
	50	65
対照化合物 B	200	27
	50	0

【0074】

【発明の効果】本発明の一般式(1)で表される化合物を有効成分として含有する農園芸用殺菌剤は、キュウ

※り、トマト、イチゴ、ブドウ等各種作物の灰色かび病に對し優れた防除効果を示し、農園芸用殺菌剤として有用である。

フロントページの続き

(51) Int.CI.

識別記号 庁内整理番号 F I

技術表示箇所

A 01 N 43/56

B

43/60

43/76

43/78

B

A

43/80

101

102

43/84

102

C 07 D 231/14

241/24	
261/08	
263/32	
275/02	
277/56	
307/68	
333/06	
333/08	
401/12	2 3 1
403/12	2 3 1
405/12	2 3 1
409/12	2 3 1
413/12	2 3 1
417/12	2 1 3
	2 3 1
	2 3 9
	2 6 1
	3 0 7
	3 3 3

(72)発明者 松永 浩文  
 千葉県茂原市東郷1144番地 三井東圧化学  
 株式会社内

(72)発明者 勝田 裕之  
 千葉県茂原市東郷1144番地 三井東圧化学  
 株式会社内

(72)発明者 柳瀬 勇次  
 千葉県茂原市東郷1144番地 三井東圧化学  
 株式会社内

(72)発明者 貴志 淳郎  
 千葉県茂原市東郷1144番地 三井東圧化学  
 株式会社内

(72)発明者 稲見 俊一  
 千葉県茂原市東郷1144番地 三井東圧化学  
 株式会社内

**Disclaimer:**

This English translation is produced by machine translation and may contain errors. The JPO, the INPI, and those who drafted this document in the original language are not responsible for the result of the translation.

**Notes:**

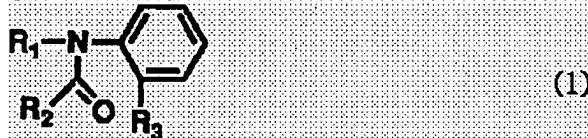
1. Untranslatable words are replaced with asterisks (\*\*\*\*).
2. Texts in the figures are not translated and shown as it is.

Translated: 06:15:31 JST 03/20/2007

Dictionary: Last updated 03/16/2007 / Priority: 1. Chemistry / 2. Biotechnology / 3. Medical/Pharmaceutical sciences

**FULL CONTENTS****[Claim(s)]**

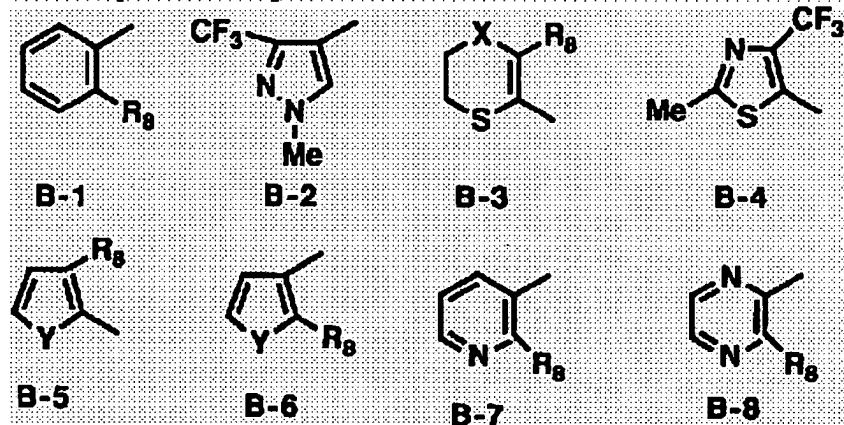
[Claim 1] general formula (1) (\*\* 1)

**[Formula 1]**

R1 means among [type the group of either A-1 expressed with the following chemical formulas (\*\* 2) to A-4, [Formula 2]

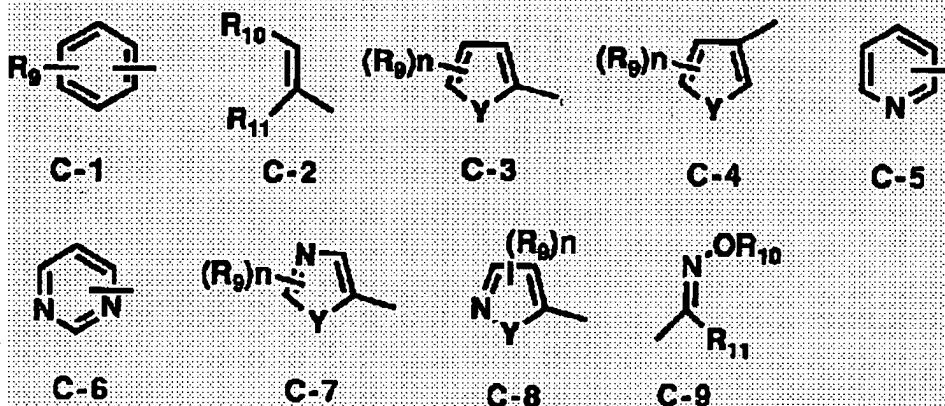


the inside of a formula, and R4 – the alkyl group of 1-8 carbon numbers, and the HAROARUKIRU machine of 1-8 carbon numbers -- It is a phenoxyethyl machine R5 The alkyl group of 1-8 carbon numbers or a phenyl group is expressed. R6 The alkyl group of 1-8 carbon numbers and the alkoxyalkyl group of 1-8 carbon numbers are expressed, and it is R7. The alkyl group of 1-8 carbon numbers is expressed. R2 The group of either B-1 expressed with the following chemical formulas (\*\* 3) to B-8 is meant, [Formula 3]



([ R8 / a halogen atom, the alkyl group of 1-8 carbon numbers, or the HAROARUKIRU machine of 1-8 carbon numbers ] among a formula) It is R3 to which X expresses a methylene group or an oxygen atom, and Y expresses an oxygen atom or a sulfur atom. The group of either C-1 expressed with the following chemical formulas (\*\* 4) to C-9 is meant.

[Formula 4]



(R9 expresses a hydrogen atom, the alkyl group of 1-8 carbon numbers, and the HAROARUKIRU machine of 1-8 carbon numbers among a formula, R10 and R11 express a hydrogen atom or the alkyl group of 1-8 carbon numbers, and Y expresses an oxygen atom or a sulfur atom.) Moreover, n is R9 when n is two or more for the integer of 1 to 3. Even if the same, you may differ. N expressed with], N-JI displacement aniline derivative.

[Claim 2] The germicide for plantation arts which contains N according to claim 1 and N-JI displacement aniline derivative as an active principle.

### [Detailed Description of the Invention]

[0001]

[Industrial Application] This invention relates to the germicide for plantation arts which contains the carboxylic amide derivative which introduced the acyl group, the alkoxyalkyl group, or the carbamoyl group into the nitrogen atom of the amide group, and this derivative as an active principle.

[0002]

[Description of the Prior Art] It is widely known from the former that extremely various carboxylic amide shows activity as a herbicide and a germicide, and there are also many drugs especially marketed as a germicide about benzoic acid amide or heterocycle carboxylic amide. For example, 3'-isopropoxy 2-methyl benzanilide or alpha, alpha, and alpha-trifluoro 3'-isopropoxy 2-torr anilide is marketed as a germicide to rice sheath blight disease, the rust of wheat, etc. as benzoic acid amide. Moreover, it is heterocycle carboxylic amide. As for \*\* 5, the 6-dihydro2-methyl 1, 4\*\*\*\*\*-3-carboxy anilide 4, and 4-dioxide, chrysanthemum white rust, 3, and 4-dihydro6-methyl 2H-Piran 5-carboxy anilide is marketed as a germicide to the rust of wheat.

[0003] Furthermore, it is in Pestic.Sci., and 38, 1-7 (1993), When thiazole carboxylic amide checks work of succinic dehydrogenase To having activity to a Rhizoctonia bacillus, Aust.J.Chem., and 36,135-147 (1983), it is indicated that pyrazole carboxylic amide has activity to a Rhizoctonia bacillus similarly.

[0004] On the other hand in JP,H5-221,994,A and JP,H6-199,803,A, it is, At least to o- of an amino group, an alkyl group, an alkoxy group, an alkenyl group, an alkenyloxy machine, It is indicated that the various aromatic-carboxylic-acid anilide which the alkynyl group, the alkynyloxy machine, the cyclo alkenyloxy machine, or the phenyl group replaced has an effect in a gray mold (*Botryotis bacillus*). However, although each compound indicated there examined the sterilization activity over a gray mold about the compound which has a hydrogen atom on the nitrogen atom of amide, and was indicated concretely there, its extermination effect was low and was not practical.

[0005]

[Problem(s) to be Solved by the Invention] Therefore, the technical problem of this invention is safe also to crops while showing the outstanding disease control effect, and it is in offering the germicide for plantation arts which has structure new moreover.

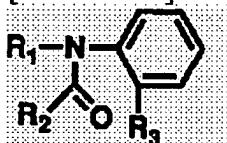
[0006]

[The means and operation for solving invention] In order to solve said technical problem, as a result of inquiring wholeheartedly, this invention person etc. found out that N and N-JI displacement aniline derivative showed a powerful extermination effect to a gray mold, and completed this invention.

[0007] That is, this invention is a general formula (1) (\*\* 5).

[0008]

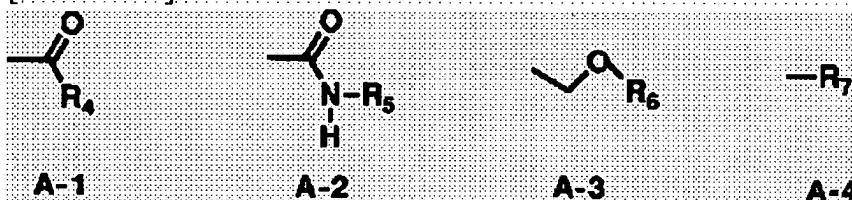
[Formula 5]



(1)

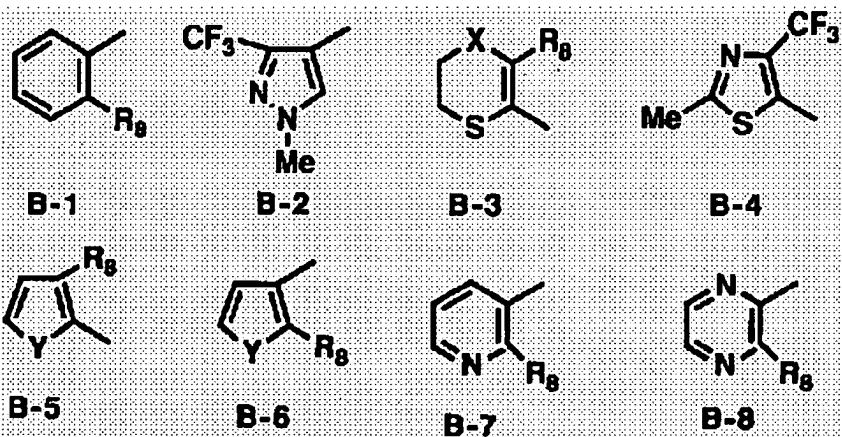
R1 means among [type the group of either A-1 expressed with the following chemical formulas (\*\* 6) to A-4, [0009]

[Formula 6]



[0010] the inside of a formula, and R4 – the alkyl group of 1-8 carbon numbers, and the HAROARUKIRU machine of 1-8 carbon numbers -- It is a phenoxyethyl machine R5 The alkyl group of 1-8 carbon numbers or a phenyl group is expressed. R6 The alkyl group of 1-8 carbon numbers and the alkoxyalkyl group of 1-8 carbon numbers are expressed, and it is R7. The alkyl group of 1-8 carbon numbers is expressed. R2 The group of either B-1 expressed with the following chemical formulas (\*\* 7) to B-8 is meant, [0011]

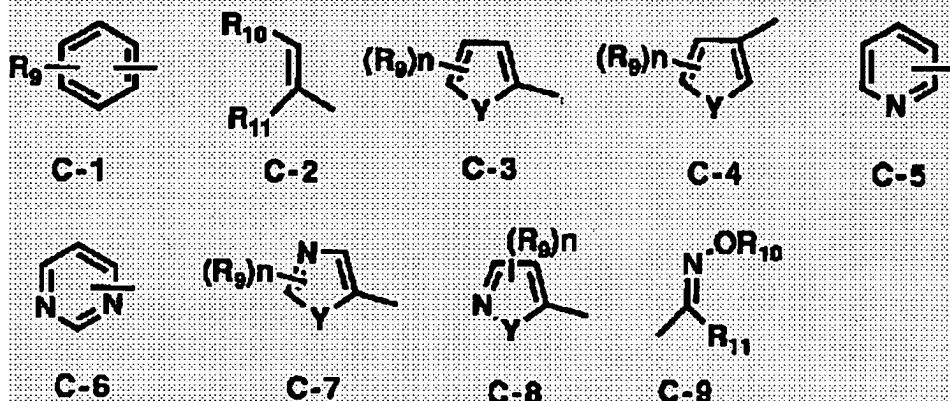
[Formula 7]



[0012] ([R<sub>8</sub> / a halogen atom, the alkyl group of 1-8 carbon numbers, or the HAROARUKIRU machine of 1-8 carbon numbers] among a formula) It is R<sub>3</sub> to which X expresses a methylene group or an oxygen atom, and Y expresses an oxygen atom or a sulfur atom. The group of either C-1 expressed with the following chemical formulas (\*\* 8) to C-9 is meant.

[0013]

[Formula 8]



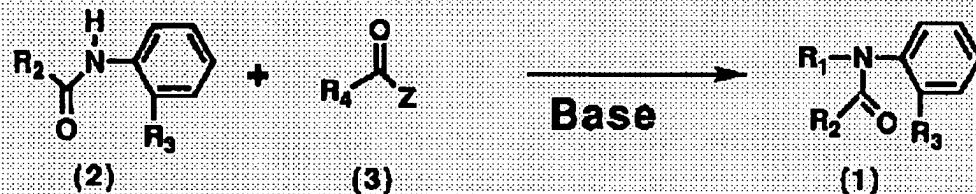
[0014] (R<sub>9</sub> expresses a hydrogen atom, the alkyl group of 1-8 carbon numbers, and the HAROARUKIRU machine of 1-8 carbon numbers among a formula, R<sub>10</sub> and R<sub>11</sub> express a hydrogen atom or the alkyl group of 1-8 carbon numbers, and Y expresses an oxygen atom or a sulfur atom.) Moreover, n is R<sub>9</sub> when n is two or more for the integer of 1 to 3. Even if the same, you may differ. It is the germicide for plantation arts which contains N expressed with], N-JI displacement aniline derivative, and this derivative as an active principle.

[0015] [ with the method which the amide derivative expressed with the general formula (1) of this invention is a new compound, and is expressed with the following reaction formulae 1 to 4 (\*\* 9) ] It can manufacture by making the compound expressed with the carboxylic amide and the general formula (3) which are expressed with a general formula (2), (4), (5), or (6) react under base existence.

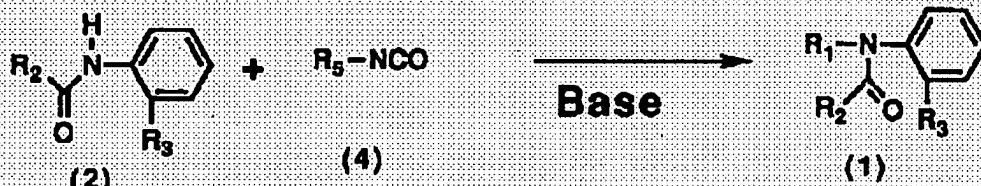
[0016]

[Formula 9]

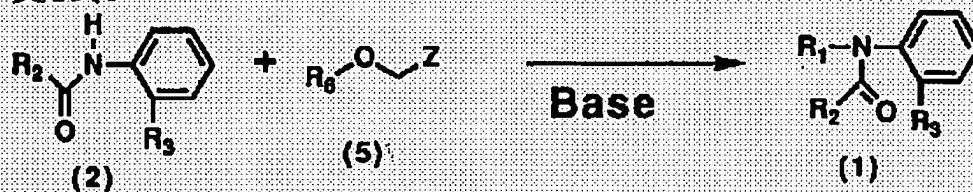
## 反応式1



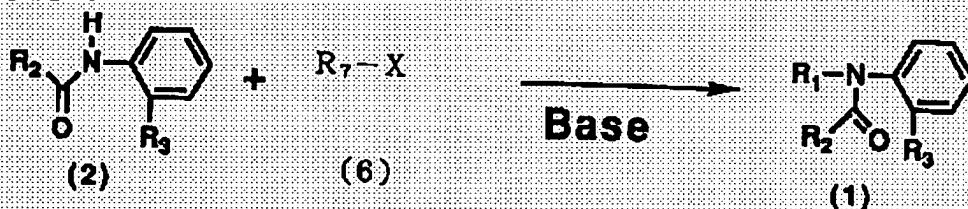
## 反応式2



## 反応式3



## 反応式4



[0017] (R1 expresses the aforementioned group A-2 with a reaction formula 1 for the aforementioned group A-1 by a reaction formula 2 among a formula, a reaction formula 4 expresses the aforementioned group A-4 for the aforementioned group A-3 by a reaction formula 3, R4, R5, R6, and R7 express the same meaning as the above, and Z expresses chlorine or bromine.)

[0018] For a reaction, that what is necessary is just inertness as a solvent which can be used for this invention. For example, ether, Ether, such as tetrahydrofuran, dimethylformamide, dimethyl sulfoxide, Aromatic hydrocarbon, such as aliphatic hydrocarbon, such as aprotic polar solvents, such as dimethyl imidazolinone, hexane, and light petroleum, benzene, and toluene, is mentioned, and these mixed solvents can also be used.

[0019] As a base used for this invention reaction, the hydride of an alkali metal and an alkaline earth metal, For example, amide of alkali metals, such as sodium hydride and potassium hydride, For example, lithium amide, sodium amide, etc.; The hydroxide of an alkali metal and an alkaline earth metal, For example, amide of alkali metals, such as sodium hydroxide, potassium hydroxide, and a calcium hydroxide, For example, carbonate of an alkali metal and an alkaline earth metal, such as lithium amide and sodium amide, For example, sodium carbonate, potassium carbonate, calcium carbonate, magnesium carbonate, etc., Hydrogencarbonate of an alkali metal and an alkaline earth metal, for example, sodium hydrogencarbonate, Potassium hydrogencarbonate and alkali metal alkyl, for example, methyl lithium, Butyl lithium, phenyl lithium, methyl magnesium chloride, Alkoxide of an

alkali metal and an alkaline earth metal, for example, sodium methoxide, Various organic base [, such as sodium ethoxide potassium t-butoxide and dimethoxy magnesium, ], for example, triethylamine, pyridine, N, and N-dimethylaniline, N-methyl piperidine, lutidine, 4-dimethylaminopyridine, etc. are mentioned, They are sodium hydride and sodium amide especially preferably. Although the amount in particular of these bases used is not restricted, it is used from 5 mol % for 20 mol over% to the carboxylic amide preferably expressed with a general formula (2).

[0020] The compound preferably used as a germicide for plantation arts with N of the general formula (1) concerning this invention which can be manufactured by the above manufacture method, and N-JI displacement aniline derivative The following table [ 1st ] (Tables 1 and 2), It enumerates to the 2nd table (Tables 3-8), the 3rd table (Tables 9 and 10), the 4th table (Tables 11-16), the 5th table (Tables 17 and 18), the 6th table (Tables 19 and 20), the 7th table (Tables 21 and 22), and the 8th table (Tables 23 and 24).

[0021]

[Table 1]

The 1st table (in the case of R2=2-chlorophenyl)

R1R3 ----- The acetyl phenylacetyl isopropenyl  
 ETANOIRUFENIRUETANOIRUISOPUROPE NIRUPUROPANOIRUFENIRU propanoyl isopropenyl  
 butanoyl Phenyl Butanoyl Isopropenyl PENTA noil Phenyl PENTANOIRU isopropenyl hexano  
 IRUFENIRUHEKISANOIRU isopropenyl N-ethyl carbamoyl phenyl N-ethyl carbamoyl isopropenyl N  
 - Methyl carbamoyl phenyl N-methyl carbamoyl isopropenyl N-phenylcarbamoyl phenyl N-phenyl  
 Carbamoyl isopropenyl phenoxy methylphenyl Phenoxyethyl Isopropenyl Methoxymethyl Phenyl

[0022]

[Table 2]

The 1st table (in the case of R2=2-chlorophenyl)

R1R3 ----- Methoxymethyl isopropenyl Methoxyethoxymethyl  
 Phenyl Methoxyethoxymethyl Isopropenyl ----- [0023]

[Table 3]

The 2nd table (in the case of R2=3-trifluoromethyl 1-methyl 4-pyrazoly)

R1R3 ----- An acetyl phenylacetyl isopropenyl  
 acetyl 2-thienyl acetyl 5-methyl 2-thienyl acetyl 3-thienyl acetyl 2-furil Acetyl 2-pyridyl Acetyl 2-  
 pyrimidyl Acetyl 5-thiazolyl acetyl 5- iso -- oxazolyl acetyl 1-(methoxy imino)  
 ECHIRUETANOIRUFENIRUETA noil isopropenyl ETANOIRU 2-thienyl ETANOIRU 5-methyl -- [ 2-  
 thienyl ETANOIRU 3-thienyl ETANOIRU 2-FURIRUETA noil 2-pyridyl ] ETANOIRU 2-pyrimidyl  
 ETANOIRU 5-thiazolyl ----- [0024]

[Table 4]

The 2nd table (continuation)

R1R3 ----- ETANOIRU 5-iso oxazolyl  
 ETANOIRU 1 - (methoxy imino) ECHIRUPUROPANOIRU phenyl propanoyl isopropenyl propanoyl 2-  
 thienyl propanoyl 5-methyl 2-thienyl Propanoyl 3-thienyl Propanoyl 2-furil Propanoyl isopropenyl  
 butanoyl 2-thienyl butanoyl 5-methyl 2-thienyl butanoyl 3- 2-pyridyl propanoyl 2 - the pyrimidyl  
 propanoyl 5-thiazolyl propanoyl 5-iso oxazolyl propanoyl 1-(methoxy imino)  
 ECHIRUBUTANOIRUFENIRU butanoyl -- Thienyl Butanoyl 2-furil Butanoyl 2-pyridyl Butanoyl 2-  
 pyrimidyl ----- [0025]

## [Table 5]

The 2nd table (continuation)

R1R3 butanoyl 5-thiazolyl -- [ butanoyl 5-iso oxazolyl butanoyl 1-(methoxy imino) ECHIRUPENTANOIRUFENIRUPENTA noil isopropenyl PENTANOIRU 2-thienyl ] PENTA noil 5-methyl 2-thienyl PENTA noil 3-thienyl PENTANO noil 1-(methoxy imino) ECHIRUHEKISANOIRUFENIRUHEKISA noil isopropenyl hexa noil 2-thienyl hexa noil 5- IRU 2-furil PENTA noil 2-pyridyl PENTA noil -- 2-pyrimidyl PENTA noil 5-thiazolyl PENTA noil 5-iso oxazolyl PENTA -- Methyl 2-thienyl Hexa noil 3-thienyl Hexa noil 2-furil -----  
----- [0026]

## [Table 6]

The 2nd table (continuation)

R1R3 hexa noil 2-pyridyl hexa noil 2-pyrimidyl hexa noil 5-thiazolyl hexa -- [ noil 5-iso oxazolyl hexa noil 1-(methoxy imino) ethyl N-ethyl carbamoyl phenyl ] N-ethyl carbamoyl Isopropenyl N-ethyl carbamoyl 2-thienyl N-ethyl carbamoyl 5-methyl 2-CHIE Nil N-ethyl carbamoyl 3-thienyl N-ethyl carbamoyl 2-furil N-ethyl carbamoyl 2-pyridyl N-ethyl carbamoyl 2-pyrimidyl N-ethyl carbamoyl 5 - Thiazolyl N-ethyl carbamoyl 5-iso oxazolyl N-ethyl carbamoyl 1- (ME) TOKISHI imino ethyl N-phenylcarbamoyl phenyl N-phenylcarbamoyl isopropenyl N-phenylcarbamoyl 2-thienyl N-phenylcarbamoyl 5-methyl 2-thienyl -----  
----- [0027]

## [Table 7]

The 2nd table (continuation)

R1R3 N-phenylcarbamoyl 3-thienyl N-phenylcarbamoyl 2-furil N-phenylcarbamoyl 2-pyridyl N-phenylcarbamoyl -- [ 5-thiazolyl N-phenylcarbamoyl 5-iso oxazolyl N-phenyl carbamoyl BAMOI ] RU 1-(methoxy imino) ethyl Phenoxyethyl Phenyl Phenoxyethyl Isopropenyl Phenoxyethyl 2-thienyl phenoxyethyl 5-methyl 2-thienyl phenoxyethyl 3-thienyl phenoxyethyl 2-furil phenoxyethyl 2-Pyridyl phenoxyethyl 2-pyrimidyl phenoxyethyl 5-thiazolyl phenoxyethyl 5-iso oxazolyl phenoxyethyl 1 - (Methoxy imino) Ethyl methoxyethyl Phenyl Methoxyethyl Isopropenyl -----  
----- [0028]

## [Table 8]

The 2nd table (continuation)

R1R3 Methoxymethyl 2-thienyl methoxymethyl 5-methyl 2-thienyl methoxymethyl 3-thienyl methoxymethyl 2-furil methoxymethyl 2-pyridyl methoxymethyl 2-pyrimidyl methoxymethyl 5-thiazolyl Methoxymethyl 5-iso oxazolyl Methoxymethyl 1 - Ethyl methoxyethoxymethyl phenyl methoxyethoxymethyl isopropenyl methoxyethoxymethyl 2-thienyl methoxyethoxymethyl 5-methyl 2-thienyl methoxyethoxymethyl 3-thienyl methoxyethoxymethyl 2-furil METOKISHIETO (Methoxy imino) KISHIMECHIRU 2-pyridyl methoxyethoxymethyl 2-pyrimidyl methoxyethoxymethyl 5-thiazolyl methoxyethoxymethyl 5-iso oxazolyl Methoxyethoxymethyl 1-(methoxy imino) ethyl -----  
----- [0029]

## [Table 9]

The 3rd table (in the case of R2=3-methyl \*\*\*\*\*- 2-IRU)

R1R3 An acetyl phenylacetyl isopropenyl ETANOIRUFENIRUETANOIRUISOPUROPE NIRUPUROPAANOIRUFENIRUPUROPAANOIRU

isopropenyl butanoyl phenyl Butanoyl Isopropenyl PENTA noil Phenyl PENTA noil Isopropenyl hexano IRUFENIRUHEKISANOIRU isopropenyl N-ethyl carbamoyl phenyl N-ethyl carbamoyl isopropenyl N - Methyl carbamoyl phenyl N-methyl carbamoyl isopropenyl N-phenylcarbamoyl phenyl N-phenylcarbamoyl Isopropenyl Phenoxy methyl Phenyl Phenoxy methyl Isopropenyl

[0030]

[Table 10]

The 3rd table (continuation)

R1R3 ----- Methoxymethyl phenyl  
methoxymethyl isopropenyl Methoxyethoxymethyl Phenyl Methoxyethoxymethyl Isopropenyl

[0031]

[Table 11]

The 4th table (in the case of R2=4-trifluoromethyl 2-methyl 5-thiazolyl)

R1R3 ----- Acetyl phenylacetyl isopropenyl  
acetyl 2-thienyl acetyl 5-methyl 2-thienyl acetyl 3-thienyl acetyl 2-furil Acetyl 2-pyridyl Acetyl 2-pyrimidyl -- acetyl 5-thiazolyl acetyl 5-iso oxazolyl acetyl 1-(methoxy imino)  
ECHIRUETANOIRUFENIRUETA noil isopropenyl -- [ ETANOIRU 2-thienyl ETANOIRU 5-methyl 2-thienyl ETANOIRU 3-thienyl ] ETANOIRU 2-furil ETANOIRU 2-pyridyl ETANOIRU 2-pyrimidyl  
ETANOIRU 5-thiazolyl ----- [0032]

[Table 12]

The 4th table (continuation)

R1R3 ----- ETANOIRU 5 - iso oxazolyl  
ETANOIRU 1-(methoxy imino) ECHIRUPUROPANOIRU phenyl propanoyl isopropenyl propanoyl 2-thienyl propanoyl 5-methyl 2-thienyl Propanoyl 3-thienyl Propanoyl 2-furil propanoyl 2-pyridyl propanoyl 2-pyrimidyl propanoyl 5-thiazolyl propanoyl -- [ 5-iso oxazolyl propanoyl 1-(methoxy imino)  
ECHIRUBUTANOIRUFENIRU butanoyl isopropenyl butanoyl 2-thienyl butanoyl ] 5-methyl 2-thienyl Butanoyl 3-thienyl Butanoyl 2-furil Butanoyl 2-pyridyl ----- [0033]

[Table 13]

The 4th table (continuation)

R1R3 ----- the butanoyl 2-pyrimidyl butanoyl --  
[ 5-thiazolyl butanoyl 5-iso oxazolyl butanoyl 1-(methoxy imino) ethyl pen TANOIRUFENIRUPENTA noil ] Isopropenyl PENTA noil 2-thienyl PENTA noil 5-methyl 2-thienyl PENTA noil 3-thienyl PENTA noil 2-furil PENTA noil 2-pyridyl PENTA noil 2-pyrimidyl PENTA noil 5 - Thiazolyl PENTA noil 5-iso oxazolyl PENTA noil 1-(methoxy imino) ethyl hexa noil FENIRUHEKISANOID \*\* isopropenyl Hexa noil 2-thienyl Hexa noil 5-methyl 2-thienyl Hexa noil 3-thienyl -----

[0034]

[Table 14]

The 4th table (continuation)

R1R3 ----- hexa noil 2-furil hexa noil 2-pyridyl  
hexa noil 2-pyrimidyl hexa -- [ noil 5-thiazolyl hexa noil 5-iso oxazolyl hexa noil 1-(methoxy imino) ethyl ] N-ethyl carbamoyl Phenyl N-ethyl carbamoyl Isopropenyl N-ethyl carbamoyl 2-thienyl N-ethyl carbamoyl 5-methyl 2-thienyl N-ethyl carbamoyl 3-thienyl N-ethyl carbamoyl 2-furil N-ethyl carbamoyl 2 - Pyridyl N-ethyl carbamoyl 2-pyrimidyl N-ethyl carbamoyl 5-CHIAZO L1 N-ethyl carbamoyl -- [ 5-iso oxazolyl N-ethyl carbamoyl 1-(methoxy imino) ethyl N-phenylcarbamoyl phenyl ] N-

phenylcarbamoyl Isopropenyl N-phenylcarbamoyl 2-thienyl ..... [0035]

[Table 15]

The 4th table (continuation)

R1R3 ..... N-phenylcarbamoyl 5-methyl 2-thienyl N-phenylcarbamoyl 3-thienyl N-phenylcarbamoyl 2-furil N-phenylcarbamoyl 2-pyridyl N-phenylcarbamoyl 2-pyrimidyl N-phenylcarbamoyl 5-thiazolyl N-phenyl KARUBA Moil 5-iso oxazolyl N-phenylcarbamoyl 1-(methoxy imino) ethyl Phenoxy methyl Phenyl FENOKISHIME Chill isopropenyl phenoxy methyl 2-thienyl phenoxy methyl 5-methyl 2-thienyl phenoxy methyl 3-thienyl phenoxy methyl 2-furil phenoxy methyl 2-pyridyl phenoxy methyl 2-pyrimidyl phenoxy methyl 5-thiazolyl phenoxy methyl 5- Iso oxazolyl phenoxy methyl 1-(methoxy imino) ethyl Methoxymethyl Phenyl

[0036]

[Table 16]

The 4th table (continuation)

R1R3 ..... Methoxymethyl isopropenyl methoxymethyl 2-thienyl methoxymethyl 5-methyl 2-thienyl methoxymethyl 3-thienyl methoxymethyl 2-furil methoxymethyl 2-pyridyl Methoxymethyl 2-pyrimidyl Methoxymethyl 5-thiazolyl Methoxymethyl 5-iso oxazolyl methoxymethyl 1- Ethyl methoxyethoxymethyl phenyl methoxyethoxymethyl isopropenyl methoxyethoxymethyl 2-thienyl methoxyethoxymethyl 5-methyl 2-thienyl methoxyethoxymethyl 3-thienyl methoxyethoxymethyl 2-furil METOKISHIETO (Methoxy imino) KISHIMECHIRU 2-pyridyl methoxyethoxymethyl 2-pyrimidyl Methoxyethoxymethyl 5-thiazolyl Methoxyethoxymethyl 5-iso oxazolyl ME TOKISHI ethoxy methyl 1-(methoxy imino) ethyl

[0037]

[Table 17]

The 5th table (in the case of R2=3-methyl 2-thienyl)

R1R3 ..... Acetyl phenylacetyl isopropenyl ETANOIRUFENIRUETANOIRUISOPUROPE NIRUPUROPANOIRU phenyl propanoyl isopropenyl Butanoyl Phenyl Butanoyl Isopropenyl PENTANOIRUFENIRUPENTANOIRU isopropenyl hexano IRUFENIRUHEKISANOIRU isopropenyl N-ethyl carbamoyl phenyl N-ethyl carbamoyl isopropenyl N-methyl carbamoyl phenyl N-methyl carbamoyl isopropenyl N-phenylcarbamoyl Phenyl N-phenylcarbamoyl Isopropenyl Phenoxy methyl Phenyl Phenoxy methyl Isopropenyl

[0038]

[Table 18]

The 5th table (continuation)

R1R3 ..... Methoxymethyl phenyl methoxymethyl isopropenyl Methoxyethoxymethyl Phenyl Methoxyethoxymethyl Isopropenyl

[0039]

[Table 19]

The 6th table (in the case of an R2=2-methyl 3-furil)

R1R3 ..... Acetyl phenylacetyl isopropenyl ETANOIRUFENIRUETANOIRUISOPUROPE NIRUPUROPANOIRU phenyl propanoyl isopropenyl Butanoyl Phenyl Butanoyl Isopropenyl PENTANOIRUFENIRUPENTANOIRU isopropenyl hexano IRUFENIRUHEKISANOIRU isopropenyl N-ethyl carbamoyl phenyl N-ethyl carbamoyl isopropenyl N-methyl carbamoyl phenyl N-methyl carbamoyl isopropenyl N-phenylcarbamoyl Phenyl N-

phenylcarbamoyl isopropenyl Phenoxyethyl Phenyl Phenoxyethyl Isopropenyl

[0040]

[Table 20]

The 6th table (continuation)

R1R3 ----- Methoxymethyl phenyl  
methoxymethyl isopropenyl Methoxyethoxymethyl Phenyl Methoxyethoxymethyl Isopropenyl  
[0041]

[Table 21]

The 7th table (in the case of R2=2-chloro 3-pyridyl)

R1R3 ----- Acetyl phenylacetyl isopropenyl  
ETANOIRUFENIRUETANOIRUISOPUROPE NIRUPUROPANOIRU phenyl propanoyl isopropenyl  
Butanoyl Phenyl Butanoyl Isopropenyl PENTANOIRUFENIRUPENTANOIRU isopropenyl hexano  
IRUFENIRUHEKISANOIRU isopropenyl N-ethyl carbamoyl phenyl N-ethyl carbamoyl isopropenyl N-  
methyl carbamoyl phenyl N-methyl carbamoyl isopropenyl N-phenylcarbamoyl Phenyl N-  
phenylcarbamoyl isopropenyl Phenoxyethyl Phenyl Phenoxyethyl Isopropenyl  
[0042]

[Table 22]

The 7th table (continuation)

R1R3 ----- Methoxymethyl phenyl  
methoxymethyl isopropenyl Methoxyethoxymethyl Phenyl Methoxyethoxymethyl Isopropenyl  
[0043]

[Table 23]

The 8th table (R2=2-chloro 3 - in the case of pyrazinyl one)

R1R3 ----- Acetyl phenylacetyl isopropenyl  
ETANOIRUFENIRUETANOIRUISOPUROPE NIRUPUROPANOIRU phenyl propanoyl isopropenyl  
Butanoyl Phenyl Butanoyl Isopropenyl PENTANOIRUFENIRUPENTANOIRU isopropenyl hexano  
IRUFENIRUHEKISANOIRU isopropenyl N-ethyl carbamoyl phenyl N-ethyl carbamoyl isopropenyl N-  
methyl carbamoyl phenyl N-methyl carbamoyl isopropenyl N-phenylcarbamoyl Phenyl N-  
phenylcarbamoyl isopropenyl Phenoxyethyl Phenyl Phenoxyethyl Isopropenyl  
[0044]

[Table 24]

The 8th table (continuation)

R1R3 ----- Methoxymethyl phenyl  
methoxymethyl isopropenyl Methoxyethoxymethyl Phenyl Methoxyethoxymethyl Isopropenyl  
[0045] [ the compound expressed with the general formula (1) of this  
invention ] Others [ diseases / (Botrytis cinerea) /, such as a cucumber, a tomato, a strawberry, and a  
grape, / gray mold ], Japanese noodles \*\*\*\* of melons (Sphaerotheca fuliginea), Japanese noodles \*\*\*  
of wheat (Erysiphe graminis f.sp.hordei, f.sp.tritici), Strawberry Japanese noodles \*\*\*\* (Sphaerotheca  
humuli), grape Japanese noodles \*\*\*\* (Uncinula necator), Apple Japanese noodles \*\*\*\* (Podosphaera  
leucotricha), An apple black spot (Venturia inaequalis), a pear black spot (Venturia nashicola), Apple  
Gymnosporangium japonicum (Gymnosporangium yamadae), A pear black rot (Alternaria kikuchiana),  
an apple spot brown stem rot (Alternaria mali), The extermination effect which was excellent to the rust  
(Puccinia striiformis, P.graminis, P.recondita, P.hordei) of wheat etc. is shown.

[0046] When using the compound expressed with the general formula (1) concerning this invention as a germicide for plantation arts Although an original object may be used as it is to the vegetation to process, generally it mixes with inertness liquid carrier or solid support, and is used as pharmaceutical preparation of the form of dust which is the formulation usually used, a water-dispersible powder, a flowable agent, an emulsion, a granule, and others generally used commonly. Furthermore, an adjuvant can also be added if it is pharmaceutical preparation top necessity.

[0047] A carrier here means the synthesis, the natural inorganic matter, or the organic substance blended in order to help attainment of the active principle to the part which should be processed and to make easy storage of an active principle compound, transportation, and handling. As a carrier, if usually used for the drugs for plantation arts, either a solid or a liquid can be used, and it is not limited to a specific thing.

[0048] For example, as a solid support, a vegetable organic substance, urea, etc., such as mineral matter, such as clay, such as montmorillonite and kaolinite, diatomaceous earth, clay, a talc, burr MYUKYU Rheydt, gypsum fibrosum, calcium carbonate, a silica gel, and ammonium sulfate, soybean meal, saw dust, and wheat flour, are raised.

[0049] As a liquid carrier, aromatic hydrocarbon, such as toluene, xylene, and cumene, Ketone, such as paraffin hydrocarbon, such as kerosene and a mineral oil, acetone, and methyl ethyl ketone, Alcohols, such as ether, such as dioxane and diethylene glycol wood ether, methanol, ethanol, propanol, and ethylene glycol, dimethylformamide, dimethyl sulfoxide, water, etc. are raised.

[0050] Furthermore, in order to reinforce the effect of this invention compound, in consideration of the pharmaceutical form of pharmaceutical preparation, an application scene, etc., it can combine independently according to the purpose, respectively, and the following adjuvants can also be used. The surface active agent, binder which are usually used for the drugs for plantation arts as an adjuvant for example, ligninsulfonic acid, alginic acid, and polyvinyl alcohol -- gum arabic, CMC sodium, etc. are independent if needed in a stabilizer (for example, use a phenol system compound, a thiol system compound, or higher fatty acid ester for antioxidantizing, phosphate is used as a pH adjuster, or light stabilizer is also sometimes used) etc. -- or it can be combined and used. Furthermore, depending on the case, an industrial use germicide, an antifungal agent, etc. can also be added for antimicrobial mildewproofing.

[0051] An adjuvant is described in more detail. For the purpose, such as emulsification, dispersion, a \*\* exhibition, humidity, binding, and stabilization, a ligninsulfonic acid salt, Alkylbenzene sulfonates, an alkyl-sulfuric-acid ester salt, polyoxyalkylene alkyl sulfate, Anionic surface active agents, such as polyoxyalkylene alkyl phosphate, Polyoxyalkylene alkyl ether, polyoxyalkylene alkyl aryl ether, Polyoxyalkylene alkylamine, polyoxyalkylene alkylamide, Polyoxyalkylene alkylamide, polyoxyalkylene alkylthio ether, Polyoxyalkylene fatty acid ester, a glycerine fatty acid ester, A sorbitan fatty acid ester, a polyoxyalkylene sorbitan fatty acid ester, Nonionic surfactants, such as polyoxypropylene polyoxyethylene block polymer, Stabilizers, such as lubricant, such as calcium stearate and a wax, and isopropyl hydronium diene phosphate, other methyl cellulose, carboxymethylcellulose, casein, gum arabic, etc. are raised. However, these components are not limited to the above thing.

[0052] [ content ] although the content of the compound expressed with the general formula (1) in the germicide for plantation arts concerning this invention changes also with formulation By dust, with a water-dispersible powder, 0.05 to 20 weight % Usually, 0.1 to 80 weight %, One to 50 weight %, with

flowable pharmaceutical preparation, one to 50 weight %, in an emulsion, are 1 to 80 weight %, and by dry flowable pharmaceutical preparation, preferably In dust, 0.5 to 5 weight %, in a water-dispersible powder, it is 5 to 80 weight %, is 0.5 to 8 weight % in a granule, and is [ at an emulsion / in flowable pharmaceutical preparation ] 5 to 50 weight % five to 20 weight % in 5 to 30 weight %, and dry flowable pharmaceutical preparation.

[0053] The content of an adjuvant is 0 to 80 weight %, and the content of a carrier is the quantity which deducted the content of the active principle compound and the adjuvant from 100 weight %.

[0054] Although seed sterilization, a foliage application, etc. are raised as the use method of this invention constituent, effect sufficient by any use methods which a person skilled in the art usually uses is demonstrated. Although amount of application and use concentration are changed according to the development grade of object crops, object disease, and disease, the pharmaceutical form of a compound, the use method, various environmental conditions, etc., when sprinkling, per [ 50-1,000g ] hectare are suitable for them as an amount of active principles, and they are per [ 100-500g ] hectare desirably. Moreover, when diluting a water-dispersible powder, a flowable agent, or an emulsion with water and sprinkling it, 200 to 20,000 times are suitable for the dilution magnification, and \*\*\*\*\* is 1,000 to 5,000 times.

[0055] Mixed preparation with these is also possible for the germicide for plantation arts of this invention not to mention mixed use with agricultural chemicals, such as other germicides, an insecticide, a herbicide, and a plant growth regulator, a soil conditioner, or an effect-of-fertilizer substance. As a germicide, for example, bird horse mackerel MEHON, hexa kona ZORU, pro KURORAZU, Acyl alanine system germicides, such as azole system germicides, such as triflumizole, metalaxyl, and OKISADIKISHIRU, Dithiocarbamate system germicides, such as benzimidazole system germicides, such as thiophanate-methyl and benomyl, and mancozeb, and tetra-chloro isophthalonitrile, sulfur, etc. are raised, and as an insecticide for example Fenitrothion, diazinon, pyridaphenthion, chlorpyrifos, Marathon, phentoate, dimethoate, methyl thiometon, prothiophos, Phosphorus system insecticides, such as DDVP, acephate, SARICHION, and EPN, NAC, Although pyrethroid system insecticides, such as the Cava mate system insecticides, such as MTMC, BPMC, pirimicarb, KARUBO sulfane, and methomyl, and etofenprox, permethrin, and fenvalerate, etc. are raised, it is not limited to this.

[0056]

[Example] Next, an example is given and the manufacturing method of this invention compound is explained concretely.

Example 1 N-acetyl N-(2-phenyl) phenyl 0.03g of 60% of synthesis sodium hydride of 4-trifluoromethyl 2-methyl thiazole 5-carboxylic amide THF10ml is made to suspend and it is N-(2-phenyl) phenyl under ice-cooling churning. The THF2ml solution of 0.20g (0.52mmol) of 4-trifluoromethyl 2-methyl thiazole 5-carboxylic amide was dropped. After agitating at this temperature for 5 minutes, 0.07g (0.98mmol) of acetic anhydride was dropped. It agitated with \*\*\*\*\* to the room temperature gradually, the solvent was poured in underwater, and ethyl acetate extracted. Water and saturation sodium bicarbonate water washed the organic layer one by one, and it dried with magnesium sulfate. It distilled off under the reduced pressure of a solvent, and the object was considered as the crystal and obtained 0.16g (71.7% of yield).

<sup>1</sup>H NMR(CDCI<sub>3</sub>, delta value): 2.04 (3H, s), 2.69 (3H, s), 7.22-7.37 (4H, m), 7.40-7.70 (5H, m) [0057]

Example 2 0.03g of 60% of synthesis sodium hydride of N-(N-ethyl carbamoyl)-N-(2-phenyl) phenyl 4-trifluoromethyl 2-methyl thiazole 5-carboxylic amide THF10ml is made to suspend and it is N-(2-

phenyl) phenyl under ice-cooling churning. The THF2ml solution of 0.25g (0.69mmol) of 4-trifluoromethyl 2-methyl thiazole 5-carboxylic amide was dropped. After agitating at this temperature for 5 minutes, isocyanic acid ethyl 0.05ml was dropped. It agitated with \*\*\*\*\* to the room temperature gradually; the solvent was poured in underwater, and ethyl acetate extracted. Water and saturation sodium bicarbonate water washed the organic layer one by one, and it dried with magnesium sulfate. It distilled off under the reduced pressure of a solvent, and the object was considered as the crystal and obtained 0.24g (80.0% of yield).

1H NMR(CDCl<sub>3</sub>, delta value): 1.21 (3H, t J = 7.3Hz), 2.57 (3H, s) and 3.41 (2H, m), 7.13-7.18 (2H, m), 7.28-7.50 (7H, m), 8.46 (1H, bs) [0058] Some of compounds of this invention manufactured by such an example of manufacture are shown in the 9th table (Tables 25-27).

[0059]

[Table 25]

9th table	compound number R1R2R3NMR (CDCl <sub>3</sub> , delta value)
1 Acetyl 4-Trifluoromethyl 2-Methyl Phenyls 2.04 (3H, S) and 2.69 (3H, S), -5-Thiazolyl 7.22-7.37 (4H, M), 7.40-7.72 (5H, M)	2 Isobutyryl 4-trifluoromethyl 2-methyl Phenyl 0.73 (3H, d J = 7.3Hz) and 1.00 (-5-thiazolyl 3H, d J = 7.3Hz), 2.50 (1H, sep-tet J=7.3Hz), 2.70 (3H, s) 7.23-7.57 (9H, m)
0.83 (3H, T J = 7.3Hz), 1.09--5-Thiazolyl 1.38 (8H, M), 2.05-2.81 (2H, M) 2.68 (3H, S), 7.22-7.57 (9H, M)	3 Hepta-Noil 4-Trifluoromethyl 2-Methyl Phenyl 2.64 (3H, s), 4.76 (1H, d J=4.3-5-thiazolyl Hz), 4.79(1H, d J = 4.3Hz) 6.69 (2H, m), 7.20-7.34 (6H, m) 7.42-7.64 (6H, m)
7.15 (2H, M), 7.34-7.54 () Phenyl 2.28 (3H, S), 6.51 (1H, Bs) Carbamoyl 14H, m	4 Phenoxy Acetyl 4-trifluoromethyl 2-methyl Phenyl 5 N-Phenyl 4-Trifluoromethyl 2-Methyl -5-Thiazolyl
	[0060]

[Table 26]

The 9th table (continuation)

	compound number R1R2R3NMR (CDCl <sub>3</sub> , delta value)
6 N-Ethyl 4-Trifluoromethyl 2-Methyl Phenyl 1.21 (3H, T J = 7.3Hz), 2.57 (3H carbamoyl -5-thiazolyl, s), 3.41 (2H, m), 7.13-7.18 (2H, m), 7.28-7.50 (7H, m); 8.46 (1H, bs)	7 Methyl 4-trifluoromethyl 2-methyl Phenyl 2.55 (3H, s), 3.25 (3H, s) and -5-thiazolyl 7.18-7.25 (2H, m), 7.31-7.48 (7H, m)
and -5-thiazolyl 10.1Hz), and 5.54 (1H, D, J= 10.1Hz), 7.15-7.19 (3H, M), 7.26-7.50 (6H, m)	8 Methoxymethyl 4-Trifluoromethyl 2-Methyl Phenyls 3.47 (3H, S), 4.43 (1H and D J=-5-Thiazolyl 10.1Hz), and 5.54 (1H, D, J= 10.1Hz), 7.15-7.19 (3H, M), 7.26-7.50 (6H, m)
9 Methoxyethoxy one 4-trifluoromethyl 2-methyl Phenyl 2.56 (3H, s), 3.37 (3H, s), 3.53 methyl -5-thiazolyl 3.57 (2H, m), 3.77-3.95 (2H, m) 4.55 (1H, d J = 10.3Hz), 5.65 (1H, d J = 10.3Hz), 7.32-7.44 (9H, m)	[0061]

[Table 27]

The 9th table (continuation)

	compound number R1R2R3NMR (CDCl <sub>3</sub> , delta value)
10 Acetyl 4-Trifluoromethyl 2-Methyl 2-Methoxy 2.17 (3H, S), 2.44 (3H, s), 2.60-5-thiazolyl Imino ethyl (3H, s) 3.94 (3H, s), 7.16 (1H, d J = 8.1Hz), 7.31-7.45 (2H, m) 7.53(1H, d J = 8.1Hz)	11 Acetyl 3-trifluoromethyl 1-methyl Phenyl 2.08 (3H, s), 3.92 (3H, s), 4-pyrazolyl 7.26-7.33 (4H, m), 7.42-7.70 (5H, m)
12 Propanoyl 4-Trifluoromethyl 2-Methyl Phenyl 0.73 (3H, T D J = 7.3Hz), 2.10-5-Thiazolyl 2.35 (2H, M)	

and 2.68 (3H, S), 7.19-7.57 (9H, m) [0062] Example 1 of reference N-(2-isopropyl phenyl)-2-methyl 4-trifluoromethyl thiazole 5-carboxylic amide (compound given in control compound A and a publication-number-No. 221,994 gazette)

It completely carried out by the same method except having used 2-isopropyl aniline as aniline and having used 2-methyl 4-trifluoromethyl thiazole 5-carboxylic acid as carboxylic acid in the example 1. The purpose compound with a fusing point of 114-115 degrees C was obtained.

[0063] Example 2 of reference N-(2-isopropyl phenyl)-2-chloro nicotinamide (compound given in a control compound B and a publication-number-No. 221,994 gazette)

It completely carried out by the same method except having used 2-isopropyl aniline as aniline in the example 1. The purpose compound with a fusing point of 123-124.5 degrees C was obtained.

[0064] The example of pharmaceutical preparation and the example of a physiology examination next the example of pharmaceutical preparation of the germicide for plantation arts concerning this invention, and the example of an examination are shown.

Example 1 of pharmaceutical preparation Grinding mixing of three copies of compounds, 20 copies of diatom earths, 30 copies of clay, and 47 copies of talcs of the dust compound number 1 was carried out uniformly, and 100 copies of dust was obtained.

[0065] Example 2 of pharmaceutical preparation Grinding mixing of 25 copies of compounds, 47 copies of diatom earths, 25 copies of clay, one copy of ligninsulfonic acid sodium, and two copies of alkyl benzene sodium sulfonate of the water-dispersible powder compound number 1 was carried out uniformly, and 100 copies of water-dispersible powders were obtained.

[0066] Example 3 of pharmaceutical preparation 50 copies of compounds of the water-dispersible powder compound number 1, 40 copies of talcs, five copies of sodium laurylphosphate, and five copies of alkyl naphthalene sulfonic acid SATORIUMU were mixed, and 100 copies of water-dispersible powders were obtained.

[0067] Example 4 of pharmaceutical preparation Preferential grinding of 50 copies of compounds, ten copies of ligninsulfonic acid sodium, five copies of alkyl sodium naphthalenesulfonate, ten copies of white carbon, and 25 copies of diatom earths of the water-dispersible powder compound number 2 was carried out, and 100 copies of water-dispersible powders were obtained.

[0068] example 5 of pharmaceutical preparation ten copies of compounds of the emulsion compound number 2, ten copies of cyclohexane, 60 copies of xylene, and Sol Ball (Toho Chemical surface active agent) – dissolution mixing of the 20 copies was carried out uniformly, and 100 copies of emulsions were obtained.

[0069] Example 6 of pharmaceutical preparation Wet grinding of 40 copies of compounds, three copies of carboxymethylcellulose, two copies of ligninsulfonic acid sodium, one copy of dioctyl sulfosuccinate sodium salt, and 54 copies of water of the flowable agent compound number 2 was carried out with the Sand grinder, and the flowable agent 100 copy was obtained.

[0070] Next, the example of an examination explains the effect as a germicide for plantation arts of this invention compound. In addition, in the example of an examination, the compound of the above-mentioned example of reference was used as a control agent.

Example 1 of an examination The water-dispersible powder adjusted to the kidney bean (carrying out [ Form : ] a New Zealand spinach top crop) which it grew two [ at a time ] at the vinyl pot 7.5cm in diameter according to the example 3 of pharmaceutical preparation to development of a cotyledon in the kidney bean gray mold disease extermination effect examination greenhouse was diluted to prescribed

concentration, and was sprinkled every 50ml per four pots. After the drug solution was air-dry, the spray inoculation of the conidium suspension ( $1 \times 10^5$  \*\*/ml) prepared from the gray mold contagion cultivated on the PDA culture medium was carried out on the cotyledon, and it maintained at 20-23 degrees C and the greenhouse beyond humidity 95% for seven days. The area which the necrotic lesion of a gray mold disease occupies was investigated seven days after inoculation according to the following index per kidney bean 1 leaf, and preventive value was computed by the following formula (several 1). A result is shown in the 10th table (Tables 28 and 29).

severity 0: --pathopoeisis-less 1: -- the area of a necrotic lesion -- 5% or less 2: -- the area of a necrotic lesion -- 5 - 25% 3: -- the area of a necrotic lesion -- 25 - 50% 4: -- the area of the necrotic lesion made severity the average of each treatment division and a non-processed division 50% or more [0071]

[Equation 1] Preventive value (%) = (severity of severity / non-processed division of 1-treatment division) x100 [0072]

[Table 28]

第10表

化合物番号	有効成分濃度 (ppm)	防除価 (%)
本発明化合物 1	200	100
	50	100
本発明化合物 4	200	100
	50	33
本発明化合物 7	200	100
	50	67
本発明化合物 8	200	100
	50	100
本発明化合物 10	200	100
	50	33
本発明化合物 11	200	100
	50	100

[0073]

[Table 29]

第10表

化合物番号	有効成分濃度 (ppm)	防除率 (%)
对照化合物 A	200	90
	50	65
对照化合物 B	200	27
	50	0

[0074]

[Effect of the Invention] The germicide for plantation arts which contains the compound expressed with the general formula (1) of this invention as an active principle shows the extermination effect which was excellent to the gray mold disease of various crops, such as a cucumber, a tomato, a strawberry, and a grape, and is useful as a germicide for plantation arts.

[Translation done.]